# (19) 世界知的所有権機関 国際事務局



# 

(43) 国際公開日 - 2003 年2 月27 日 (27.02.2003)

# PCT

# (10) 国際公開番号 WO 03/015781 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: A61P 3/10, C07D 471/04 A61K 31/444, 31/506,

(21) 国際出願番号:

PCT/JP02/08276

(22) 国際出願日:

2002年8月14日(14.08.2002)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

特願2001-246344 2001年8月15日(15.08.2001) JP

- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 三共株 式会社 (SANKYO COMPANY, LIMITED) [JP/JP]; 〒 103-8426 東京都 中央区 日本橋本町3丁目5番1号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 藤原 俊彦 (FUJI-WARA,Toshihiko) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号三共株式会社内 Tokyo (JP). 牛山茂 (USHIYAMA,Shigeru) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号三共株式会社内 Tokyo (JP). 木村 富美夫 (KIMURA,Tomio) [JP/JP]; 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号三共株式会社内 Tokyo (JP).

- (74) 代理人: 大野彰夫, 外(OHNO,Akio et al.); 〒140-8710 東京都品川区広町1丁目2番58号三共株式会社内 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

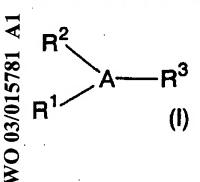
#### 添付公開書類:

#### - 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: NOVEL ANTIDIABETIC PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS

(54) 発明の名称: 新規抗糖尿病医薬組成物



(57) Abstract: Pharmaceutical compositions for the prevention or treatment of diabetes, containing as the active ingredient compounds represented by the general formula (I), or pharmacologically acceptable salts, esters, or other derivatives thereof: (I) wherein A is benzene, pyridine, pyridazine, pyrimidine, pyrrole, furan, thiophene, pyrazole, imidazole, isoxazole, or isothiazole, each being optionally substituted;  $R^1$  is aryl or heteroaryl, each being optionally substituted;  $R^2$  is optionally substituted nitrogenous heteroaryl; and  $R^3$  is a mono- or poly-cyclic nitrogenous heterocycle which may be substituted, with the proviso that the A-constituent atoms to which  $R^1$  and  $R^3$  bonded are each adjacent to the A-constituent atom to which  $R^2$  is bonded.

/続葉有/

#### (57) 要約:

本発明は、下記一般式(I)を有する化合物、その薬理上許容される塩、その薬理上許容されるエステル又はその他の誘導体を有効成分として含有する、糖尿病を予防若しくは治療するための医薬組成物に関する:

(式中、

Aは、置換されてもよい、ベンゼン、ピリジン、ピリダジン、ピリミジン、ピロール、フラン、チオフェン、ピラゾール、イミダゾール、イソキサゾール若しくはイソチアゾールを示し、R<sup>1</sup>は、置換されてもよい、アリール基又はヘテロアリール基を示し、R<sup>2</sup>は、置換されてもよい含窒素ヘテロアリール基を示し、R<sup>3</sup>は、単環若しくは複環性の置換されてもよい含窒素複素環を示す。但し、R<sup>1</sup>及びR<sup>3</sup>が結合している環式基A上の原子は、それぞれ、R<sup>2</sup>が結合している環式基A上の原子に隣接している。)。

## 明細書

## 新規抗糖尿病医薬組成物

## [技術分野]

本発明は、糖尿病を予防若しくは治療するための医薬組成物に関する。

# ·[背景技術]

現在、用いられている抗糖尿病薬としては、インスリン製剤、スルホニルウレア剤、アルドース還元酵素阻害剤、αーグルコシダーゼ阻害剤、インスリン抵抗性改善剤などが用いられている。

一方、本発明の抗糖尿病医薬組成物の有効成分は、一部、EP-1070711 A に 開示されており、それらには炎症性サイトカインの産生を抑制する作用がある ことも開示されている。

しかしながら、そのような作用を有する化合物が実際に抗糖尿病薬として有用であることをデータと共に示している報告はない。

## [発明の開示]

本発明者らは、サイトカイン産生抑制剤の薬理作用について鋭意研究を重ね、 特定の構造を有するサイトカイン産生抑制剤が、抗糖尿病薬として有効であることを見出し、本発明を完成した。

即ち、本発明は、

## (1) 下記一般式 (I):

$$R^2$$
 A  $R^3$  (I)

{式中、

Aは、置換基群δで置換されてもよい、ベンゼン、ピリジン、ピリダジン、

ピリミジン、ピロール、フラン、チオフェン、ピラゾール、イミダゾール、イ ソキサゾール及びイソチアゾールから選択される三価の基を示し、

 $R^{1}$ は、アリール基;置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたアリール基;ヘテロアリール基;又は置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたヘテロアリール基を示し、

 $R^2$ は、窒素原子を少なくとも一つ有するヘテロアリール基;又は置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換された、窒素原子を少なくとも一つ 有するヘテロアリール基を示し、

R<sup>3</sup>は、下記一般式 (IIa)、(IIb)、(IIc) 又は (IId) を有する基:

$$(IIa) \qquad (IIb) \qquad (R^5)_n \qquad (R^5)_n$$

[式中、

点線を含む結合は、単結合又は二重結合を示し、

mは、1又は2を示し、

 $R^5$ は、水素原子、置換基群  $\alpha$ 、置換基群  $\beta$  及び置換基群  $\gamma$  から任意に選択される基を示し、

nは1乃至3を示し(nが2以上の場合は、R  $^5$ は、同一又は異なっても良い)、

D及びEの一方は、窒素原子を示し、他方は、式>C(R<sup>6</sup>) - を有する基 (式中、R<sup>6</sup>は、水素原子、置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される 1 個の 基を示す。)を示し、

D 及びE の一方は、式>N(R  $^6$  )を有する基(式中、R  $^6$  は、水素原子、置換基群  $\alpha$ 及び置換基群  $\beta$  から選択される 1 個の基を示す。)を示し、他方は、式>C(R  $^6$ )(R  $^6$   $^{\circ}$ )を有する基(式中、R  $^6$ 及びR  $^6$   $^{\circ}$  は、同一若しくは異なって、水素原子、置換基群  $\alpha$ 及び置換基群  $\beta$  から選択される 1 個の基を示す。)を示し、

D及びEを含む環Bは、4乃至7員へテロシクリル環(該環は飽和であるか不飽和であり;アリール基、ヘテロアリール基、シクロアルキル基又はヘテロシクリル基と縮環していてもよい。)を示す。]示し、

置換基群 $\alpha$ は、水酸基、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、ハロゲノ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、ハロゲノ低級アルキルチオ基及び式-NR $^a$ R $^b$ を有する基(式中、R $^a$ 及びR $^b$ は、同一若しくは異なって、それぞれ、水素原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、アラルキル基又は低級アルキルスルホニル基を示すか、或いは、R $^a$ 及びR $^b$ が結合している窒素原子と一緒になって、ヘテロシクリル基を形成する。)からなる群を示し、

置換基群 $\beta$ は、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、アラルキル基、シクロアルキル基、置換基群 $\alpha$ から選択される基で置換された低級アルキル基、置換基群 $\alpha$ から選択される基で置換された低級アルケニル基および置換基群 $\alpha$ から選択される基で置換されたアルキニル基からなる群を示し、

置換基群 $\gamma$ は、オキソ基、ヒドロキシイミノ基、低級アルコキシイミノ基、低級アルキレン基、低級アルキレンジオキシ基、低級アルキルスルフィニル基、低級アルキルスルホニル基、アリール基、置換基群 $\alpha$ 及び置換基群 $\beta$ から選択される基で置換されたアリール基、アリールオキシ基、置換基群 $\alpha$ 及び置換基群 $\beta$ から選択される基で置換されたアリールオキシ基、低級アルキリデン基およびアラルキリデン基からなる群を示し、

置換基群 $\delta$ は、置換基群 $\beta$ から選択される1つの基;置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたシクロアルキル基;アリール基;置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたアリール基;ヘテロアリール基;置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたヘテロアリール基;ヘテロシクリル基;および置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたヘテロシクリル基からなる群を示す。

但し、 $R^1$ 及び $R^3$ が結合している環A上の原子は、それぞれ、 $R^2$ が結合している環A上の原子に隣接している。}

を有する化合物、その薬理上許容される塩、その薬理上許容されるエステル又 はその他の誘導体を有効成分として含有する、糖尿病を予防若しくは治療する ための医薬組成物に関する。

本発明の医薬組成物として、好適には、有効成分である化合物(I)において、

- (2) Aが、2個の置換基群  $\delta$ で置換されてもよいピロール、1 個の置換基群  $\delta$ で置換されてもよいピラゾール及び1 個の置換基群  $\delta$ で置換されてもよい イミダゾールから選択される三価の基である医薬組成物、
- (3) Aが、2個の置換基群  $\delta$  で置換されてもよいピロール及び 1 個の置換基群  $\delta$  で置換されてもよいピラゾールから選択される三価の基である医薬組成物、
- (4)上記一般式(I)を有する化合物が、下記のいずれか1個の一般式で表される化合物である医薬組成物:

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $R^3$ は前述したものと同意義を示し、 $R^4$ 及び $R^4$ )は、同一又は異なって、水素原子又は置換基群  $\delta$  を示す。)、

(5)上記一般式(I)を有する化合物が、下記一般式で表される化合物である医薬組成物:

(式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $R^3$ は前述したものと同意義を示し、 $R^4$ 及び $R^4$ )は、同一又は異なって、水素原子又は置換基群  $\delta$ を示す。)

- (6)  $R^1$ が、アリール基;又は置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたアリール基である医薬組成物、
- (7)  $R^1$ が、フェニル、ナフチル、又は置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたフェニル若しくはナフチルである医薬組成物、
- (8)  $R^1$ が、フェニル、又は置換基群  $\alpha^1$  及び置換基群  $\beta^1$  から選択される基で置換されたフェニルであり、

置換基群  $\alpha^1$ が、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、ハロゲノ低級アルコキシ基および式-NR aR bを有する基(式中、R a及びR bの一方は水素原子又は低級アルキル基を示し、他方は水素原子、低級アルキル基又はアラルキル基を示す。)からなる群を示し、

置換基群 β 1 が、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、ニトロ低級アルキル基、アミノ低級アルキル基、モノ(低級アルキル) アミノ低級アルキル基およびモノ(アラルキル) アミノ低級アルキル基およびモノ(アラルキル) アミノ低級アルキル基からなる群を示す医薬組成物、

- (9) R<sup>1</sup>が、フェニル、又はハロゲン原子、ハロゲノ低級アルキル基および ハロゲノ低級アルコキシ基からなる置換基群から選択される基で置換された フェニルである医薬組成物、
- $(1\ 0)\ R^1$ が、フェニル、4-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、3-クロロフェニル、3, 4-ジフルオロフェニル、3, 4, 5-トリフルオロフェニル、3-ジフルオロメトキシフ

エニル又は3-トリフルオロメチルフェニルである医薬組成物、

- (11)  $R^2$ が、窒素原子を1若しくは2個含む5乃至6員へテロアリール基;又は置換基群 $\alpha$ 及び置換基群 $\beta$ から選択される基で置換された、窒素原子を1若しくは2個含む5乃至6員へテロアリール基である医薬組成物、
- (12) $R^2$ が、ピリジル、ピリミジニル、又は置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたピリジル若しくはピリミジニルである医薬組成物、
- (13)  $R^2$ が、4-ピリジル、4-ピリミジニル、又は置換基群  $\alpha$  及び置換 基群  $\beta$  から選択される基で置換された 4-ピリジル若しくは 4-ピリミジニ ルである医薬組成物、
- (14)  $R^2$ が、4-ピリジル、4-ピリミジニル、又は置換基群  $\alpha$  及び置換 基群  $\beta$  から選択される 1 個の基で 2 位が置換された 4-ピリジル若しくは 4-ピリミジニルである医薬組成物、
- (15)  $R^2$ が、4-ピリジル、4-ピリミジニル、又はメトキシ、アミノ、メチルアミノ、ベンジルアミノ及び $\alpha-$ メチルベンジルアミノからなる置換基群から選択される 1 個の基で 2 位が置換された 4-ピリジル若しくは 4-ピリミジニルである医薬組成物、
- (16) R<sup>3</sup>が、一般式 (IIa)、(IIb) 又は (IId) を有する基であり、

D及びEを含む環Bが、1個の窒素原子を含有する5又は6員へテロサイクル環(該環は飽和であるか不飽和であり;アリール基、ヘテロアリール基、シクロアルキル基又はヘテロシクリル基と縮環していてもよい。)である医薬組

成物、

- (18) R<sup>3</sup>が、一般式(IIa) 又は(IIb) を有する基であり、D及び Eを含む環Bが、ピロリジン又はピロリン環である医薬組成物、
- (19) R<sup>3</sup>が、一般式(IIa)を有する基であり、D及びEを含む環Bが、 ピロリジン又はピロリン環である医薬組成物、
- (20) Dが、式>C (R6) -を有する基(式中、R6は、水素原子、置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される 1 個の基を示す。)であり、

Eが窒素原子である医薬組成物、

- (21) Dが、式>CH-を有する基である医薬組成物、
- (22) mが1である医薬組成物、
- (23)  $R^5$ が、水素原子、置換基群  $\alpha$ 、置換基群  $\beta$  及び置換基群  $\gamma$  から任意に選択される基であり、n が 1 又は 2 である医薬組成物、
- (24) $R^{5}$ が、水素原子、水酸基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、ハロゲノ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、オキソ基、アリール基、置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたアリール基、低級アルキレン基、低級アルキレンジオキシ基、低級アルキルスルホニル基、アリールオキシ基、置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたアリールオキシ基、低級アルキリデン基並びにアラルキリデン基から任意に選択される基であり、n が 1 又は 2 である医薬組成物、
- (25) R<sup>5</sup>が、水素原子、水酸基、フッ素原子、塩素原子、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、メチル基、エチル基、プロピル基、ブチル基、フェニル基、置換基群α及び置換基群βから選択される基で置換されたフェニル基、フェノキシ基、メチリデン基、エチリデン基、プロピリデン基並びにベンジリデン基から任意に選択される基であり、nが1又は2である医薬組成物、
- (26) R<sup>5</sup>が、水素原子、メトキシ基、メチル基、エチル基、プロピル基、プチル基、フェニル基、フェノキシ基、メチリデン基、エチリデン基、プロピリデン基又はベンジリデン基であり、nが1である医薬組成物、
- (27) 置換基群δが、低級アルキル基;置換基群αから選択される基で置換

された低級アルキル基;置換基群  $\alpha$ 、置換基群  $\beta$  及び置換基群  $\gamma$  から選択される基で置換されたアリール基;ヘテロシクリル基;及び置換基群  $\alpha$ 、置換基群  $\beta$  及び置換基群  $\gamma$  から選択される基で置換されたヘテロシクリル基からなる群である医薬組成物、

- (28)置換基群 $\delta$ が、低級アルキル基;ハロゲノ低級アルキル基;及び置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたフェニル基からなる群である医薬組成物及び
- (29) 置換基群  $\delta$  が、メチル基、エチル基、プロピル基及びフェニル基からなる群である医薬組成物である。

更に、上記(1)に記載の一般式(I)を有する化合物において、

(2) 乃至(5);(6) 乃至(10);(11) 乃至(15);(16) 乃至(19);(20) 乃至(21);(22);(23) 乃至(26);及び(27) 乃至(29)からなる8個の群から任意に選択した要件の組み合わせを充足するような医薬組成物も好適である。

特に好適には、(1)に記載の医薬組成物において、

- (30)一般式(I)を有する化合物が、下記から選択される化合物である医薬組成物である:
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[(2R, 8aS) 2-7ェニルー 1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[(8aS)-2-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン<math>-7-7ル]-3-(ピリジン-4-7) -1 H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル) -4-[(8aS)-2- メチリデン-1,2,3,5,6,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4- イル)-1 H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル) -4-[(8aS)-2-xチル-3, 5, 6, 8a-テトラヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン<math>-4-イ

- ル) -1H-ピロール、
- ・4- [(2S, 8aS) -2-エチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサ ヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピ リジン-4-イル) -1H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル) 4-[(2S, 8aS) 2-7]ロピルー 1, 2, 3, 5, 6, 8a-4 + サヒドロインドリジン 7-4ル] 3-(ピリジン 4-4) 1H-ピロール、
- ・5 (3 フルオロフェニル) 3 (1, 2, 3, 5, 6, 8 a  $\wedge$  キサヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル)ピラゾール、・5 (4 フルオロフェニル) 3 (1, 2, 3, 5, 6, 8 a  $\wedge$  キサヒドロインドリジン- 7 イル)- 4 (ピリジン- 4 イル)ピラゾール、・5 (4 フルオロフェニル) 3 (2 メチル- 1, 2, 3, 5, 6, 8 a  $\wedge$  キサヒドロインドリジン- 7 イル)- 4 (ピリジン- 4 イル)ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-7)ェニル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-4 サヒドロインドリジン-7 イル)-4 (ピリジン-4 イル)ピラゾール、

- 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール、
- ・5-(4-フルオロフェニル) -3-(2-メチリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・3 (2 エチリデン- 1 , 2 , 3 , 5 , 6 , 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル) 5 (4 フルオロフェニル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール、
- ・5-(4-フルオロフェニル)-3-(2-プロピリデン-1, 2, 3, 5,
   6,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
  - ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-3) チルー3, 5, 6, 8a-5トラヒドロインドリジン-7 ーイル)-4 ー(ピリジン-4 ーイル)ピラゾール、

  - ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-7)ロピル-3, 5, 6, 8a-7テトラヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール、

  - ・4 [(8aS) 1, 2, 3, 5, 6, 8a n + サヒドロインドリジン 7 イル] 2 フェニル 3 (ピリジン 4 イル) 1 H ピロール、
  - ・2-(4-フルオロフェニル) -4-[(8 a S) -1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール、
  - ・2- (4-フルオロフェニル) -3- (ピリジン-4-イル) -4- [(8

- ・2 (3-クロロフェニル) 4-[(8aS)-1, 2, 3, 5, 6, 8] a  $\wedge$  + サヒドロインドリジン (2-7)
- ・4 [(8 a S) 1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル] 2 (3 トリフルオロメチルフェニル) 3 (ピリジン- 4 イル) 1 + ピロール、
- 6,8 a へキサヒドロインドリジン- 7 イル] 3 (ピリジン- 4 イル) 1 H ピロール、
- ・4- [(8 a S) -2-エチル-3, 5, 6, 8 a テトラヒドロインドリジン-7-イル] -2- (4-フルオロフェニル) -3- (ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル) 4 [(8aS) 2 プロピル 3, 5,

- 6,8 a テトラヒドロインドリジン- 7 イル] 3 (ピリジン- 4 イル) 1 H ピロール、
- ・4-[(8 a S) -2-エチリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール、

- +5-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-3-(3,
- 5, 6, 8 a テトラヒドロインドリジン-7-イル) ピラゾール。

本発明の「糖尿病を予防若しくは治療するための医薬組成物」は、好適には、

- (31) I 型糖尿病を予防若しくは治療するための医薬組成物である。 更に、本発明は、
- (32)糖尿病(好適には、I型糖尿病)を予防若しくは治療するための医薬 組成物を製造するための、上記(1)乃至(30)から選択されるいずれか1 項に特定された化合物、その薬理上許容される塩、その薬理上許容されるエス テル又はその他の誘導体の、有効成分としての使用及び
- (33)上記(1)乃至(30)から選択されるいずれか1項に記載の医薬組成物の有効量を哺乳動物(特にヒト)に投与することからなる、糖尿病(好適には、1型糖尿病)の予防若しくは治療方法を提供する。

上記一般式(I)を有する化合物は、即ち、下記のいずれか1個の一般式を示す:

上記一般式で表される化合物の中でも、好適な化合物は、下記のいずれかの 一般式を示す:

上記一般式で表される化合物の中でも、特に好適な化合物は、下記一般式を 示す:

(式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>及びR<sup>4</sup>, は、前記と同意義を示す。) 上記一般式(I)において、

 $R^1$ 、「置換基群 $\gamma$  ] 及び [置換基群 $\delta$ ] の定義における「アリール基」;  $R^1$ 及び [置換基群 $\gamma$ ] の定義における「置換基群 $\alpha$ 及び置換基群 $\beta$ から選択される基で置換されたアリール基」の「アリール基」; 並びに [置換基群 $\delta$ ] の定義における「置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたアリール基」の「アリール基」は、例えば、フェニル、ナフチル、フェナンスリル、アントラセニルのような炭素数 $\delta$ 70至14個のアリール基であり、好適には、フェニル又はナフチルであり、最適にはフェニルである。

尚、上記「アリール基」は、炭素数3万至10個のシクロアルキル基と縮環 していてもよく、そのような基は、例えば、5-インダニルなどである。

 $R^1$ 及び [置換基群  $\gamma$ ] の定義における「置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたアリール基」は、好適には、置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される 1 乃至 4 個の基で置換されたアリール基であり、更に好適には、置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される 1 乃至 3 個の基で置換されたアリール基であり、好適な具体例は、4 ーフルオロフェニル、3 ーフルオロフェニル、4 ークロロフェニル、3 ークロロフェニル、3 ークロフェニル、3 ークフロフェニ

ル、3,4-ジクロロフェニル、3,4,5-トリフルオロフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、3-ジフルオロメトキシフェニル、3-トリフルオロメトキシフェニル又は3-トリフルオロメチルフェニル基である。

[置換基群  $\delta$ ] の定義における「置換基群  $\alpha$ 、置換基群  $\beta$ 及び置換基群  $\gamma$ から選択される基で置換されたアリール基」は、好適には、置換基群  $\alpha$ 、置換基群  $\beta$  及び置換基群  $\gamma$  から選択される 1 乃至 4 個の基で置換されたアリール基であり、更に好適には、置換基群  $\alpha$ 、置換基群  $\beta$  及び置換基群  $\gamma$  から選択される 1 乃至 3 個の基で置換されたアリール基であり、より更に好適には、「低級アルキルチオ基」、「ハロゲノ低級アルキルチオ基」、「低級アルキルスルフィニル基」及び「低級アルキルスルホニル基」から選択される 1 個の基で置換されたアリール基である。その好適な具体例は、4-メチルチオフェニル、4-エチルチオフェニル、4-エーエール、4-エースースープロピルチオフェニル、4-エースープロピルスルフィニルフェニル、4-エチルスルフィニルフェニル、4-エチルスルカフィニルフェニル、4-エチルスルカフェニル、4-エチルスルカフェニル、4-エチルスルカフェニル、4-エチルスルホニルフェニル、4-エチルスルホニルフェニル、4-エチルスルホニルフェニルスは 4-プロピルスルカスによる。

R¹及び[置換基群δ]の定義における「ヘテロアリール基」; R¹の定義における「置換基群α及び置換基群βから選択される基で置換されたヘテロアリール基」の「ヘテロアリール基」; 並びに、[置換基群δ]の定義における「置換基群α、置換基群β及び置換基群γから選択される基で置換されたヘテロアリール基」の「ヘテロアリール基」は、例えば、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ドリアゾリル、テトラゾリル、チアジアゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラジニルのような、硫黄原子、酸素原子及び/又は窒素原子を1乃至3個含む5乃至7員ヘテロアリール基であり、好適には、フリル、チエニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジンル、ピリジニル、ピリシニル、ピカジニル、ピリジル、ピリジル、ピリジンニル、ピリジニル、ピリジニル、ピリジニル、ピリジニル、ピリジニル、ピリジニルのような、1若しくは2個の硫黄原子、酸素原子及び/又は窒素原子を含む5乃至6員ヘテロアリール基であり、更に好適には、フリル、チエニル、ピリジル又はピリミジニルである。

尚、上記「ヘテロアリール基」は、他の環式基(例えば、アリール基、炭素数3万至10個のシクロアルキル基のような環式基)と縮環していてもよく、そのような基は、例えば、インドリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、キノリル、イソキノリル、キナゾリニル、テトラヒドロキノリル又はテトラヒドロイソキノリルである。

 $R^1$ の定義における「置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたヘテロアリール基」は、好適には、置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される 1 乃至 3 個の基で置換されたヘテロアリール基であり、更に好適には、置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される 1 乃至 2 個の基で置換されたヘテロアリール基である。その好適な具体例は、5 ーフルオロー 2 ーフリル、4 ークロロー 2 ーチエニル、5 ージフルオロメトキシー 3 ーフリル、5 ートリフルオロメチルー 3 ーチエニル又は 5 ーフルオロー 2 ーオキサゾリル基である。

[置換基群  $\delta$  ] の定義における「置換基群  $\alpha$  、置換基群  $\beta$  及び置換基群  $\gamma$  から選択される基で置換されたヘテロアリール基」は、好適には、置換基群  $\alpha$  、置換基群  $\beta$  及び置換基群  $\gamma$  から選択される 1 乃至 3 個の基で置換されたヘテロアリール基であり、更に好適には、置換基群  $\alpha$  、置換基群  $\beta$  及び置換基群  $\gamma$  から選択される 1 乃至 2 個の基で置換されたヘテロアリール基である。その好適な具体例は、2 ーメチルチオー 5 ーピリジル、3 ーメチルチオー 6 ーピリダジニル、2 ーメチルチオー 5 ーピリジンニル、2 ーメチルスルフィニルー 5 ーピリジル、3 ーメチルスルフィニルー 6 ーピリダジニル、2 ーメチルスルフィニルー 5 ーピリジンニル、2 ーメチルスルフィニルー 5 ーピリジンニル、2 ーメチルスルフィニルー 5 ーピリミジニル、2 ーメチルスルホニルー 5 ーピリミジニル、2 ーメチルスルホニルー 5 ーピリミジニルスルホニルー 5 ーピリミジニルスルホニルー 5 ーピリミジニルスルホニルー 5 ーピリミジニルスルホニルー 5 ーピリミジニルスルホニルー 5 ーピリミジニルスルホニルー 5 ーピリミジニル基である。

R<sup>2</sup>の定義における、「窒素原子を少なくとも一つ有するヘテロアリール基」、及び「置換基群 α 及び置換基群 β から選択される基で置換された、窒素原子を少なくとも一つ有するヘテロアリール基」の「窒素原子を少なくとも一つ有するヘテロアリール基」は、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、チアジアゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジニル、ピラ

ジニルのような、少なくとも1個の窒素原子を含み、更に1若しくは2個の硫 黄原子、酸素原子及び/又は窒素原子を含んでいてもよい5乃至7員へテロア リール基であり、好適には、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、オキサゾ リル、イソキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリダジニ ル、ピリミジニル、ピラジニルのような、1個の窒素原子を含み、更に硫黄原 子、酸素原子又は窒素原子を1個含んでいてもよい5乃至6員へテロアリール 基であり、更に好適には、イミダゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピリミジ ニル又はピラジニルのような、窒素原子を1若しくは2個含む5乃至6員へテロアリール基であり、特に好適には、ピリジル又はピリミジニルであり、最適 には、4ーピリジル又は4ーピリミジニルである。

R<sup>2</sup>の定義における「置換基群α及び置換基群βから選択される基で置換さ れた、窒素原子を少なくとも一つ有するヘテロアリール基」は、好適には、置 換基群α及び置換基群βから選択される1乃至3個の基で置換された基であ り、更に好適には、置換基群α及び置換基群βから選択される1乃至2個の基 で置換された基であり、より更に好適には、置換基群α及び置換基群βから選 択される1個の基で置換された基であり、特に好適には、置換基群 $\alpha$ 及び置換 基群 B から選択される 1 個の基で 2 位が置換された、4 - ピリジル若しくは 4... ーピリミジニルであり、最も好適には、式-NR<sup>a</sup>R<sup>b</sup>を有する基(式中、R<sup>a</sup> 及びRbは、同一若しくは異なって、それぞれ、水素原子、低級アルキル基、 低級アルケニル基、低級アルキニル基、アラルキル基、又は低級アルキルスル ホニル基であるか、或いは、R®及びRbが結合している窒素原子と一緒にな って、ヘテロシクリル基を形成する。)及び式-NR®R®を有する基(式中、 R®及びRbは、前記と同意義である。)で置換された低級アルキル基から選択 される1個の基で2位が置換された、4-ピリジル若しくは4-ピリミジニル である。その好適な具体例は、2-アミノ-4-ピリジル、2-アミノー4-ピリミジニル、2 - メチルアミノ-4-ピリジル、2 - メチルアミノ-4-ピ リミジニル、2 ーメトキシー4 ーピリジル、2 ーメトキシー4 ーピリミジニル、 2-ベンジルアミノー4ーピリジル、2-ベンジルアミノー4-ピリミジニル 又は2-(α-メチルベンジルアミノ)-4-ピリジル又は2-(α-メチル

WO 03/015781

ベンジルアミノ)-4-ピリミジニル基である。

D及びEを含む環Bの定義における、「4乃至7員へテロシクリル環」は、D; E;並びに、炭素原子、窒素原子、酸素原子、硫黄原子、式>SOを有する基及び式>SO₂を有する基からなる群より選択される2乃至5個の原子又は基からなる4乃至7員へテロシクリル環を意味し、少なくとも1個の窒素原子を含有する4乃至7員のヘテロシクリル環(即ち、飽和ヘテロシクリル環又は不飽和ヘテロシクリル環)であり、好適には、1個の窒素原子を含有し、更に窒素原子、酸素原子、硫黄原子、式>SOを有する基及び式>SO₂を有する基からなる群より選択される1個の原子又は基を含有していてもよい5又は6員ヘテロシクリル環であり、更に好適には、ピロリジン、ピロリン、イミダゾリジン、イミダゾリン、ピラゾリジン、ピラゾリン、オキサゾリジン、チアゾリジン、ピペリジン、テトラヒドロピリジン、ジヒドロピリジン、ピペラジン、モルホリン又はチオモルホリン環であり、特に好適には、ピロリジン、ピロリン又はイミダゾリン環であり、最適には、ピロリジン又はピロリン環である。

尚、上記「ヘテロシクリル環」は、上記「アリール基」、上記「ヘテロアリール基」、「シクロアルキル基」又は「ヘテロシクリル基」と縮環していてもよく、そのような環は、例えば、テトラヒドロキノリン、オクタヒドロキノリン、デカヒドロキノリン、テトラヒドロイソキノリン、オクタヒドロイソキノリン、デカヒドロイソキノリン、インドリン、オクタヒドロインドール、イソインドリン又はオクタヒドロイソインドールである。

[ここにおいて、

「シクロアルキル基」は、シクロプロピル、シクロプチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、シクロヘプチルのような炭素数3万至7個のシクロアルキル基であり、好適には、炭素数3万至6個のシクロアルキル基である。

「ヘテロシクリル基」は、1乃至3個の硫黄原子、酸素原子及び/又は窒素原子を有する4乃至7員のヘテロシクリル基であり、好適には、1若しくは2個の硫黄原子、酸素原子及び/又は窒素原子を含む4乃至7員ヘテロシクリル基であり、更に好適には、窒素原子を1個含み、更に、酸素原子、硫黄原子又

は窒素原子を1個含んでいてもよい5又は6員へテロシクリル基であり、そのような基は、例えば、アゼチジニル、ピロリジニル、ピロリニル、イミダゾリジニル、イミダゾリニル、ピラゾリジニル、オキサゾリジニル、チアゾリジニル、ピペリジル、テトラヒドロピリジル、ジヒドロピリジル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニル又はホモピペリジルである。1

[置換基群 $\beta$ ] の定義における「シクロアルキル基」、及び、[置換基群 $\delta$ ] の定義における「置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたシクロアルキル基」の「シクロアルキル基」は、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロペキシル、シクロペプタニルのような炭素数 3 乃至 7 個のシクロアルキル基であり、好適には、炭素数 3 乃至 6 個のシクロアルキル基であり、更に好適には、シクロペンチル又はシクロヘキシルである。

[置換基群 $\delta$ ]の定義における、「ヘテロシクリル基」及び「置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたヘテロシクリル基」の「ヘテロシクリル基」は、1乃至3個の硫黄原子、酸素原子及び/又は窒素原子を有する4乃至7員のヘテロシクリル基であり、好適には、1若しくは2個の硫黄原子、酸素原子及び/又は窒素原子を含む4乃至7員ヘテロシクリル基であり、更に好適には、窒素原子を1個含み、更に、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよい5又は6員ヘテロシクリル基であり、そのような基は、例えば、アゼチジニル、ピロリジニル、ピロリニル、イミダゾリジニル、イミダゾリニル、ピラゾリニル、オキサゾリジニル、ピラゾリニル、オキサゾリジニル、テアゾリジニル、ピープジニル、ピープジニル、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、ピープジール、チオモルホリニル又はホモピペリジルである。

 $R^a$ 、 $R^b$ 及び [置換基群  $\beta$ ] の定義における「低級アルキル基」;並びに、 [置換基群  $\beta$ ] の定義における「置換基群  $\alpha$  から選択される基で置換された低級アルキル基」の「低級アルキル基」は、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソプチル、S-ブチル、S-ブチル、S-プチル、S-プチル、S-プチル、S- アルテル、S- アルテル、S- アルテル、S- アルテル、S- アルテル、S- アルテル、S- アルプロピル、S- アルプロピル、S- アルプロピル、S- アルプロピル、S- アルプロピル、S- アルプロピル、S- アルペンチル、S- アルペンチル、S- アルペンチル、S- アルペンチル、S- ア

チルペンチル、1-メチルペンチル、3,3-ジメチルプチル、2,2-ジメチルプチル、1,1-ジメチルプチル、1,2-ジメチルプチル、1,3-ジメチルプチル、2,3-ジメチルプチル、2-エチルプチルのような炭素数1乃至6個の直鎖若しくは分枝鎖アルキル基であり得、好適には、炭素数1乃至4個のアルキル基であり、更に好適には、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル又はプチルであり、特に好適には、メチル、エチル又はプロピルである。

 $R^a$ 、 $R^b$ 及び [置換基群  $\beta$ ] の定義における 「低級アルケニル基」; 並びに、 [置換基群  $\beta$ ] の定義における 「置換基群  $\alpha$  から選択される基で置換された低級アルケニル基」 の低級アルケニル基は、ビニル、2-プロペニル、1-メチルー2-プロペニル、2-メチルー2-プロペニル、2-エチルー2-プロペニル、2-エチルー2-プロペニル、2-メチルー2-プテニル、1-メチルー2-プテニル、1-メチルー3-プテニル、1-メチルー3-プテニル、1-メチルー3-プテニル、1-メチルー3-プテニル、1-メチルー3-プテニル、1-メチルー3-プテニル、1-メチルー3-ペンテニル、1-メチルー3-ペンテニル、1-メチルー3-ペンテニル、1-メチルー1-ペンテニル、1-スキセニル、1-スキセニル、1-スキセニル、1-スキセニル、1-スキセニル、1-スキセニル 1-スキセニル 1-スキャム 1-ストル 1-ストル

 $R^a$ 、 $R^b$ 及び [置換基群  $\beta$ ] の定義における「低級アルキニル基」; 並びに、 [置換基群  $\beta$ ] の定義における「置換基群  $\alpha$  から選択される基で置換された低級アルキニル基」の低級アルキニル基は、エチニル、2-プロピニル、1-メチル-2-プロピニル、2-プチニル、1-メチル-2-プチニル、3-プチニル、1-メチル-3-プチニル、2-メチル-3-プチニル、1-メチル-3-プチニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-2-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-3-ペンチニル、1-メチル-1-メチル-1-メチル-1-ペンチニル、1-メチル-1-ペンチニル、1-メチル-1-ペンチニル、1-メチル-1-ペンチニル、1-メチル-1-ペンチニル、1-メチル-1-ペンチニル、1-メチル-1-ペンチニル、1-メチル-1-ペンチニル、1-メチル-1-ペンチニル、1-メチル-1-ペンチニル、1-スチルー1-ペンチニル、1-スチルー1-ペンチニル、1-スチルー1-ペンチニル、1-スチルー1-ペンチニル、1-スチルー1-ペンチニル、1-スチルー1-ペンチニル、1-スチルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー1-ストルー1-ペンチニル、1-ストルー

アルケニル基であり、更に好適には、炭素数2又は3個のアルケニル基である。

あり得、好適には、炭素数2乃至4個のアルキニル基であり、更に好適には、 炭素数2又は3個のアルキニル基である。

 $R^a$ 、 $R^b$ 及び [置換基群 $\beta$ ] の定義における「アラルキル基」は、前記「ア リール基」が前記「低級アルキル基」に結合した基であり得、そのような基は、 好適には、ペンジル、インデニルメチル、フェナンスレニルメチル、アントラ セニルメチル、 $\alpha$ ーナフチルメチル、 $\beta$ ーナフチルメチル、ジフェニルメチル、 トリフェニルメチル、 $\alpha$ ーナフチルジフェニルメチル、9ーアンスリルメチル、 ピペロニル、1-フェネチル、2-フェネチル、1-ナフチルエチル、2-ナ フチルエチル、1 - フェニルプロピル、2 - フェニルプロピル、3 - フェニル プロピル、1-ナフチルプロピル、2-ナフチルプロピル、3-ナフチルプロ ピル、1-フェニルプチル、<math>2-フェニルプチル、<math>3-フェニルプチル、<math>4-フェニルプチル、1 ーナフチルプチル、2 ーナフチルプチル、3 ーナフチルプ チル、4ーナフチルプチル、1-フェニルペンチル、2-フェニルペンチル、 3-フェニルペンチル、4-フェニルペンチル、5-フェニルペンチル、1-ナフチルペンチル、2-ナフチルペンチル、3-ナフチルペンチル、4-ナフ チルペンチル、5 - ナフチルペンチル、1 - フェニルヘキシル、2 - フェニル シル、6-フェニルヘキシル、1-ナフチルヘキシル、2-ナフチルヘキシル、 3-ナフチルヘキシル、4-ナフチルヘキシル、5-ナフチルヘキシル、6-ナフチルヘキシルを挙げることができる。これらのうち、ベンジル、フェナン スレニルメチル、アントラセニルメチル、 $\alpha$ ーナフチルメチル、 $\beta$ ーナフチル メチル、ジフェニルメチル、トリフェニルメチル、9-アンスリルメチル、ピ ペロニル、1-フェネチル、2-フェネチル、1-フェニルプロピル、2-フ ェニルプロピル、3-フェニルプロピル、1-フェニルプチル、2-フェニル プチル、3-フェニルブチル又は4-フェニルブチルである。

尚、当該「アラルキル基」のアリール部分は、前記「置換基群 $\alpha$ 」及び「置換基群 $\beta$ 」から選択される 1 乃至 3 個の基で置換されていてもよく、そのような置換されたアラルキル基は、例えば、2 ーフルオロベンジル、3 ークロロベンジル、3 ークロロベンジル、

4-クロロベンジル、2-プロモベンジル、3-プロモベンジル、4-プロモ ペンジル、3,5-ジフルオロベンジル、2,5-ジフルオロフェネチル、2, 6-ジフルオロペンジル、2,4-ジフルオロフェネチル、3,5-ジブロモ ベンジル、2,5ージプロモフェネチル、2,6-ジクロロベンジル、2,4 ージクロロフェネチル、2,3,6ートリフルオロベンジル、2,3,4ート リフルオロフェネチル、3,4,5-トリフルオロベンジル、2.5.6-ト リフルオロフェネチル、2,4,6-トリフルオロベンジル、2,3,6-ト リプロモフェネチル、2,3,4-トリプロモベンジル、3,4,5-トリプ ロモフェネチル、2,5,6ートリクロロベンジル、2,4,6ートリクロロ フェネチル、1-フルオロ-2-ナフチルメチル、2-フルオロ-1-ナフチ ルエチル、3 - フルオロー 1 - ナフチルメチル、1 - クロロー 2 - ナフチルエ チル、2-クロロー1ーナフチルメチル、3-ブロモー1ーナフチルエチル、  $3, 8 - \forall \forall \forall 1 - 1 - \forall 1 + \forall 2, 3 - \forall \forall 1 - 1 - \forall 2 + \forall 3 + \forall 4 + \forall 4$ ルエチル、4,8-ジフルオロー1ーナフチルメチル、5,6-ジフルオロー 1ーナフチルエチル、3,8ージクロロー1ーナフチルメチル、2,3ージク ロロー1ーナフチルエチル、4,8-ジプロモ-1ーナフチルメチル、5,6 ージブロモー1ーナフチルエチル、2,3,6-トリフルオロー1ーナフチル メチル、2,3,4ートリフルオロー1ーナフチルエチル、3,4,5ートリ フルオロー1ーナフチルメチル、4,5,6ートリフルオロー1ーナフチルエ チル、2,4,8-トリフルオロ-1-ナフチルメチル、ビス(2-フルオロ フェニル)メチル、3-フルオロフェニルフェニルメチル、ビス(4-フルオ ロフェニル)メチル、4-フルオロフェニルフェニルメチル、ピス(2-クロ ロフェニル) メチル、ビス(3-クロロフェニル) メチル、ビス(4-クロロ フェニル)メチル、4-クロロフェニルフェニルメチル、2-プロモフェニル フェニルメチル、3 - プロモフェニルフェニルメチル、ビス(4 - プロモフェ ニル)メチル、ピス(3,5-ジフルオロフェニル)メチル、ピス(2,5-ジフルオロフェニル)メチル、ビス(2,6-ジフルオロフェニル)メチル、 2, 4-ジフルオロフェニルフェニルメチル、ビス(3,5-ジプロモフェニ ル) メチル、2, 5 - ジブロモフェニルフェニルメチル、2, 6 - ジクロロフ

エニルフェニルメチル、ビス(2,4-ジクロロフェニル)メチル、ビス(2,3,6-トリフルオロフェニル)メチルのようなハロゲン原子で置換されたアラルキル基;

2-トリフルオロメチルペンジル、3-トリフルオロメチルフェネチル、4-トリフルオロメチルベンジル、2 ートリクロロメチルフェネチル、3 ージクロ ロメチルベンジル、4-トリクロロメチルフェネチル、2-トリプロモメチル ベンジル、3 - ジプロモメチルフェネチル、4 - ジプロモメチルベンジル、3、 5-ビストリフルオロメチルフェネチル、2,5-ビストリフルオロメチルベ ンジル、2,6-ピストリフルオロメチルフェネチル、2,4-ピストリフル オロメチルベンジル、3,5-ピストリプロモメチルフェネチル、2.5-ピ スジプロモメチルベンジル、2,6-ビスジクロロメチルメチルフェネチル、 2,4-ビスジクロロメチルベンジル、2,3,6-トリストリフルオロメチ ルフェネチル、2,3,4-トリストリフルオロメチルベンジル、3,4,5 ートリストリフルオロメチルフェネチル、2,5,6-トリストリフルオロメ チルベンジル、2, 4, 6-トリストリフルオロメチルフェネチル、2, 3, 6-トリストリプロモメチルベンジル、2,3,4-トリスジプロモメチルフ エネチル、3,4,5-トリストリプロモメチルベンジル、2,5,6-トリ スジクロロメチルメチルフェネチル、2,4,6-トリスジクロロメチルベン ジル、1 - トリフルオロメチル- 2 - ナフチルエチル、2 - トリフルオロメチ N-1-T アルメチル、N-1-T アルステル、N-1-T アルスチル、N-1-T アルスチル、N-1-Tートリクロロメチルー2ーナフチルメチル、2ージクロロメチルー1ーナフチ ルエチル、3-トリプロモメチル-1-ナフチルメチル、3,8-ビストリフ ルオロメチルー1ーナフチルエチル、2,3ーピストリフルオロメチルー1ー ナフチルメチル、4,8-ビストリフルオロメチル-1-ナフチルエチル、5. 6-ビストリフルオロメチル-1-ナフチルメチル、3、8-ビストリクロロ メチルー1ーナフチルエチル、2,3ービスジクロロメチルー1ーナフチルメ チル、4,8-ビスジプロモメチル-1-ナフチルエチル、5,6-ビストリ プロモメチルー1ーナフチルメチル、2,3,6-トリストリフルオロメチル -1-ナフチルエチル、2、3、4-トリストリフルオロメチル-1-ナフチ

ルメチル、3,4,5-トリストリフルオロメチル-1-ナフチルエチル、4, 5,6-トリストリフルオロメチル-1-ナフチルメチル、2,4,8-トリ ストリフルオロメチルー1ーナフチルメチル、ピス(4ートリフルオロメチル フェニル)メチル、4-トリフルオロメチルフェニルフェニルメチル、ビス(2 ートリクロロメチルフェニル) メチル、ビス(3-トリクロロメチルフェニル) メチル、ビス (4-トリクロロメチルフェニル) メチル、2-トリプロモメチ ルフェニルフェニルメチル、3-トリプロモメチルフェニルフェニルメチル、 ピス(4-トリプロモメチルフェニル)メチル、ピス(3,5-ピストリフル オロメチルフェニル)メチル、ビス(2,5-ビストリフルオロメチルフェニ ル) メチル、ビス(2,6-ピストリフルオロメチルフェニル) メチル、2, 4-ビストリフルオロメチルフェニルフェニルメチル、ビス(3,5-ビスト リプロモメチルフェニル) メチル、2,5 -ピストリプロモメチルフェニルフ ェニルメチル、2,6-ピストリクロロメチルフェニルフェニルメチル、ビス (2,4-ビストリクロロメチルフェニル)メチル、ビス(2,3,6-トリ ストリフルオロメチルフェニル)メチルのようなハロゲノ低級アルキル基で置 換されたアラルキル基;

2-メチルベンジル、3-メチルベンジル、4-メチルベンジル、2-メチルフェネチル、4-メチルフェネチル、2-エチルベンジル、3-プロピルフェネチル、4-エチルベンジル、2-プチルフェネチル、3-ペンチルベンジル、4-ペンチルフェネチル、3, 5-ジメチルベンジル、2, 5-ジメチルフェネチル、3, 5-ジメチルフェネチル、3, 5-ジプチルベンジル、2, 6-ジプロピルベンジル、2, 4-ジプロピルベンジル、2, 4-ジプロピルフェネチル、2, 6-ジプロピルベンジル、2, 4-ジプロピルフェネチル、2, 3, 6-トリメチルベンジル、2, 4, 6-トリメチルベンジル、2, 5, 6-トリメチルフェネチル、2, 3, 6-トリブチルフェネチル、2, 3, 4-トリズチルベンジル、2, 4, 6-トリブチルフェネチル、2, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 15, 15, 15, 15, 17, 1

エチル、2-プロピルー1-ナフチルメチル、3-ブチルー1-ナフチルエチ ル、3, 8 - ジメチル - 1 - ナフチルメチル、<math>2, 3 - ジメチル - 1 - ナフチルエチル、4,8-ジメチル-1-ナフチルメチル、5,6-ジメチル-1-ナフチルエチル、3,8-ジエチル-1-ナフチルメチル、2,3-ジプロピ ルー1ーナフチルメチル、4, 8 - ジ ペ ン チ ルー1 - ナ フ チ ル エチ ル 、<math>5 , 6ージプチルー1ーナフチルメチル、2,3,6-トリメチル-1-ナフチルメ チル、2,3,4ートリメチルー1ーナフチルエチル、3,4,5ートリメチ ルー1ーナフチルメチル、4,5,6-トリメチルー1-ナフチルメチル、2,4,8-トリメチルー1-ナフチルメチル、ピス(2-メチルフェニル)メチ ル、3-メチルフェニルフェニルメチル、ピス(4-メチルフェニル)メチル、 4-メチルフェニルフェニルメチル、ピス(2-エチルフェニル)メチル、ビ ス(3-エチルフェニル)メチル、ピス(4-エチルフェニル)メチル、2-プロピルフェニルフェニルメチル、3 - プロピルフェニルフェニルメチル、ビ ス(4-プロピルフェニル)メチル、ビス(3,5-ジメチルフェニル)メチ  $\nu$ 、ピス(2, 5-ジメチルフェニル)メチル、ピス(2, 6-ジメチルフェ ニル) メチル、2, 4-ジメチルフェニルフェニルメチル、ビス(3,5-ジ プロピルフェニル) メチル、2、5ージプロピルフェニルフェニルメチル、2、 6-ジエチルフェニルフェニルメチル、ビス(2,4-ジエチルフェニル)メ チル、ビス(2,3,6-トリメチルフェニル)メチルのような低級アルキル 基で置換されたアラルキル基:

トキシフェネチル、2,3,6-トリプトキシベンジル、2,3,4-トリペ ントキシフェネチル、3、4、5 - トリプトキシベンジル、2、5、6 - トリ プロポキシフェネチル、2,4,6-トリプロポキシベンジル、1-メトキシ -2-ナフチルメチル、2-メトキシ-1-ナフチルメチル、3-メトキシー 1-ナフチルエチル、1-エトキシー2-ナフチルメチル、2-プロポキシー 1-ナフチルメチル、3-ブトキシ-1-ナフチルエチル、3,8-ジメトキ シー1ーナフチルメチル、2,3ージメトキシー1ーナフチルメチル、4,8 ージメトキシー1ーナフチルエチル、5,6ージメトキシー1ーナフチルメチ ル、3、8-ジエトキシー1-ナフチルメチル、2、3-ジプロポキシー1-ナフチルエチル、4,8-ジペントキシー1-ナフチルメチル、5,6-ジプ トキシー1ーナフチルメチル、2,3,6ートリメトキシー1ーナフチルエチ ル、2,3,4ートリメトキシー1ーナフチルメチル、3,4,5ートリメト キシー1ーナフチルメチル、4,5,6ートリメトキシー1ーナフチルエチル、 2, 4, 8-トリメトキシー1-ナフチルメチル、ピス(2-メトキシフェニ ル) メチル、3-メトキシフェニルフェニルメチル、ビス(4-メトキシフェ ニル) メチル、4-メトキシフェニルフェニルメチル、ビス(2-エトキシフ ェニル) メチル、ビス(3-エトキシフェニル) メチル、ビス(4-エトキシ フェニル) メチル、2 ープロポキシフェニルフェニルメチル、3 ープロポキシ フェニルフェニルメチル、ビス(4-プロポキシフェニル)メチル、ビス(3. 5-ジメトキシフェニル)メチル、ビス(2,5-ジメトキシフェニル)メチ ル、ビス(2,6-ジメトキシフェニル)メチル、2,4-ジメトキシフェニ ルフェニルメチル、ビス(3,5-ジプロポキシフェニル)メチル、2,5-ジプロポキシフェニルフェニルメチル、2,6-ジエトキシフェニルフェニル メチル、ビス(2,4ージエトキシフェニル)メチル、ビス(2,3,6ート リメトキシフェニル)メチルのような低級アルコキシ基で置換されたアラルキ ル基:

2- アミノフェネチル、3- アミノベンジル、4- アミノフェネチル、3, 5- ジアミノベンジル、2, 5- ジアミノフェネチル、2, 6- ジアミノベンジル、2, 4- ジアミノフェネチル、2, 3, 6- トリアミノベンジル、2, 3,

4-トリアミノフェネチル、3 ,4 ,5-トリアミノベンジル、2 ,5 ,6-トリアミノフェネチル、2,4,6-トリアミノベンジル、1-アミノ-2-ナフチルメチル、2-アミノ-1-ナフチルエチル、3-アミノ-1-ナフチ ルメチル、3,8-ジアミノ-1-ナフチルメチル、2,3-ジアミノ-1-ナフチルエチル、4,8-ジアミノ-1-ナフチルメチル、5,6-ジアミノ -1-ナフチルメチル、2,3,6-トリアミノ-1-ナフチルエチル、2, 3, 4ートリアミノー1ーナフチルメチル、3, 4, 5ートリアミノー1ーナ フチルメチル、4,5,6-トリアミノ-1-ナフチルエチル、2,4,8-トリアミノ-1-ナフチルメチル、ピス(2-アミノフェニル)メチル、3-アミノフェニルフェニルメチル、ピス(4-アミノフェニル)メチル、4-ア ミノフェニルフェニルメチル、ピス(3,5-ジアミノフェニル)メチル、ビ ス(2,5-ジアミノフェニル)メチル、ピス(2,6-ジアミノフェニル) メチル、2,4-ジアミノフェニルフェニルメチル、ビス(2,3,6-トリ アミノフェニル)メチルのようなアミノ基で置換されたアラルキル基; 2-ニトロフェネチル、3-ニトロベンジル、4-ニトロベンジル、4-ニト ロフェネチル、3,5-ジニトロベンジル、2,5-ジニトロフェネチル、2, 6ージニトロペンジル、2, 4ージニトロフェネチル、2, 3, 6ートリニトー。 ロベンジル、2,3,4ートリニトロフェネチル、3,4,5ートリニトロベ ンジル、2,5,6-トリニトロフェネチル、2,4,6-トリニトロペンジ ル、1-ニトロー2-ナフチルメチル、2-ニトロー1-ナフチルエチル、3ーニトロー1ーナフチルメチル、3,8ージニトロー1ーナフチルメチル、2, 3-ジニトロ-1-ナフチルエチル、<math>4,8-ジニトロ-1-ナフチルメチル、5, 6-ジニトロ-1-ナフチルメチル、2, 3, 6-トリニトロ-1-ナフチルエチル、2,3,4-トリニトロ-1-ナフチルメチル、3,4,5-ト リニトロー1ーナフチルメチル、4,5,6-トリニトロー1ーナフチルエチ ル、2,4,8-トリニトロー1ーナフチルメチル、ピス(2-ニトロフェニル) メチル、3-ニトロフェニルフェニルメチル、ピス(4-ニトロフェニル)メ チル、4-ニトロフェニルフェニルメチル、ピス(3,5-ジニトロフェニル) メチル、ピス(2,5-ジニトロフェニル)メチル、ピス(2,6-ジニトロ

フェニル) メチル、2, 4 - ジニトロフェニルフェニルメチル、ビス(2, 3, 6 - トリニトロフェニル) メチルのようなニトロ基で置換されたアラルキル基;又は

2-シアノフェネチル、3-シアノベンジル、4-シアノベンジル、4-シア ノベンジルジフェニルメチル、4 ーシアノフェネチル、3,5 ージシアノベン ジル、2,5-ジシアノフェネチル、2,6-ジシアノベンジル、2,4-ジ シアノフェネチル、2,3,6-トリシアノベンジル、2,3,4-トリシア ノフェネチル、3,4,5ートリシアノベンジル、2,5,6ートリシアノフ エネチル、2, 4, 6 - トリシアノベンジル、1 - シアノー2 - ナフチルメチ ル、3-シアノー1-ナフチルメチル、3, 8-ジシアノー1-ナフチルメチ ル、2, 3-ジシアノ-1-ナフチルエチル、<math>4, 8-ジシアノ-1-ナフチルメチル、5,6-ジシアノ-1-ナフチルメチル、2,3,6-トリシアノ -1 - ナフチルエチル、 2 、 3 、 4 - トリシアノ -1 - ナフチルメチル、 3 、 4,5-トリシアノ-1-ナフチルメチル、4,5,6-トリシアノ-1-ナ フチルエチル、2, 4, 8-トリシアノ-1-ナフチルメチル、ビス(2-シ アノフェニル) メチル、3-シアノフェニルフェニルメチル、ビス(4-シア ノフェニル)メチル、4ーシアノフェニルフェニルメチル、ピス(3,5ージ シアノフェニル)メチル、ビス(2,5-ジシアノフェニル)メチル、ビス(2, 6 - ジシアノフェニル) メチル、2, 4 - ジシアノフェニルフェニルメチル、 ピス(2,3,6-トリシアノフェニル)メチルのようなシアノ基で置換され たアラルキル基であり得、好適には、無置換のアラルキル基又はハロゲン原子、 低級アルキル基若しくは低級アルコキシ基で置換されたアラルキル基であり、 更に好適には、無置換のアラルキル基又はハロゲン原子若しくは低級アルキル 基で置換されたアラルキル基であり、最も好適には、無置換のアラルキル基で ある。

 $R^a$ 、 $R^b$ 及び [置換基群 r] の定義における「低級アルキルスルホニル基」は、上記「低級アルキル」にスルホニル ( $-SO_2-$ ) が結合した基であり、好適には、炭素数 1 乃至 4 個の直鎖若しくは分枝鎖アルキルスルホニル基であり、更に好適には、メチルスルホニル、エチルスルホニル、プロピルスルホニ

ル、イソプロピルスルホニル又はプチルスルホニルであり、特に好適には、メ チルスルホニル、エチルスルホニル又はプロピルスルホニルである。

R®及びR®が、それらが結合している窒素原子と一緒になって形成するへテロシクリル基は、窒素原子を1個含み、更に、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよい4乃至7員へテロシクリル基であり、そのような基は、例えば、1ーアゼチジニル、1ーピロリジニル、1ーピロリニル、1ーイミダゾリジニル、1ーイミダゾリニル、1ーピラゾリジニル、1ーピラゾリニル、3ーオキサゾリジニル、3ーチアゾリジニル、1ーピペリジル、テトラヒドロピリジン-1ーイル、ジヒドロピリジン-1ーイル、1ーピペラジニル、4ーモルホリニル、4ーチオモルホリニル、1ーホモピペリジル、8ーアザビシクロ[3.2.1]オクタン-8ーイル、8ーアザビシクロ[3.2.1]オクテン-8ーイル、9ーアザビシクロ[3.3.1]ノナン-9ーイル又は9ーアザビシクロ[3.3.1]ノネン-9ーイルである。

尚、これらの基は、アリール基又はヘテロアリール基と縮環していてもよく、 そのような基は、例えば、テトラヒドロキノリン-1-イル又はテトラヒドロ イソキノリン-2-イルである。

[置換基群 α] の定義における「ハロゲン原子」は、フッ素原子、塩素原子、、、 臭素原子又はヨウ素原子であり得、好適には、フッ素原子又は塩素原子である。

[置換基群α]の定義における「低級アルコキシ基」は、上記「低級アルキル基」に酸素原子が結合した基であり、好適には、炭素数1乃至4個の直鎖若しくは分枝鎖アルコキシ基であり、更に好適には、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ又はプトキシであり、特に好適には、メトキシ、エトキシスはプロポキシである。

[置換基群α]の定義における「ハロゲノ低級アルコキシ基」は、上記「低級アルコキシ基」の1個若しくは2個以上の水素原子が上記「ハロゲン原子」で置換された基であり、好適には、炭素数1乃至4個ハロゲノ低級アルコキシ基であり、更に好適には、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ又は2,2,2ートリフルオロエトキシであり、特に好適には、ジフルオロメトキシである。

[置換基群α]の定義における「低級アルキルチオ基」は、上記「低級アルキル基」に硫黄原子が結合した基であり、好適には、炭素数1乃至4個の直鎖若しくは分枝鎖アルキルチオ基であり、更に好適には、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ又はプチルチオであり、特に好適には、メチルチオ、エチルチオ又はプロピルチオである。

[置換基群  $\alpha$ ] の定義における「ハロゲノ低級アルキルチオ基」は、上記「低級アルキルチオ基」の1個若しくは2個以上の水素原子が上記「ハロゲン原子」で置換された基であり、好適には、炭素数1乃至4個ハロゲノ低級アルキルチオ基であり、更に好適には、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ又は2,2,2-トリフルオロエチルチオである。

[置換基群 γ ]の定義における「低級アルコキシイミノ基」は、ヒドロキシイミノ基の水素原子が上記「低級アルキル基」で置きかえられた基であり、好適には炭素数 1 乃至 4 個のアルコキシイミノ基であり、更に好適には、メトキシイミノ、エトキシイミノ又はプロポキシイミノである。

[置換基群  $\gamma$ ] の定義における「低級アルキレン基」は、エチレン、トリメチレン、プロピレン、テトラメチレン、1ーメチルトリメチレン、2ーメチルトリメチレン、1,1ージメチルトリメチレン、1,1ージメチルトリメチレン、2,2ージメチルトリメチレン、1,2ージメチルトリメチレン、0ような炭素数2乃至6個の直鎖若しくは分枝鎖アルキレン基であり、好適には、炭素数2乃至4個の直鎖若しくは分枝鎖アルキレン基であり、更に好適には、エチレン、トリメチレン、プロピレン又はテトラメチレンである。尚、これらは、環B上に置換することにより、スピロ状の環を形成していてもよい。

【置換基群 ↑ 】の定義における「低級アルキレンジオキシ基」は、アルキレン部分が、メチレン、エチレン、トリメチレン、プロピレン、テトラメチレン、1-メチルトリメチレン、2,1-ジメチルエチレン、ペンタメチレン、1,1-ジメチルトリメチレン、2,2-ジメチルトリメチレン、1,2-ジメチルトリメチレン、ヘキサメチレンのような炭素数1乃至6個の直鎖若しくは分枝鎖アルキレン基であり、好適には、炭素数1乃至

4個の直鎖若しくは分枝鎖アルキレンジオキシ基であり、更に好適には、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリメチレンジオキシ、プロピレンジオキシ又はテトラメチレンジオキシである。尚、これらは、環B上に置換することにより、スピロ状の環を形成していてもよい。

[置換基群  $\gamma$ ] の定義における「低級アルキルスルフィニル基」は、上記「低級アルキル」にスルフィニル(-SO-)が結合した基であり、好適には、炭素数 1 乃至 4 個の直鎖若しくは分枝鎖アルキルスルフィニル基であり、更に好適には、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル、プロピルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル又はブチルスルフィニルであり、特に好適には、メチルスルフィニル、エチルスルフィニル又はプロピルスルフィニルである。

[置換基群 $\gamma$ ]の定義における、「アリールオキシ基」、及び「置換基群 $\alpha$ 及び置換基群 $\beta$ から選択される基で置換されたアリールオキシ基」のアリールオキシ基は、上記「アリール基」に酸素原子が結合した基であり、好適には、フェノキシ、ナフチルオキシ、フェナントリルオキシ又はアントラセニルオキシであり、更に好適には、フェノキシ又はナフチルオキシであり、最も好適には、フェノキシである。

[置換基群 r] の定義における「低級アルキリデン基」は、炭素数 1 乃至 6 個の直鎖若しくは分枝鎖アルキリデン基であり、好適には、メチリデン、エチリデン、プロピリデン、1 - メチルエチリデン、ブチリデン、1 - メチルプロピリデンのような炭素数 1 乃至 4 個の直鎖若しくは分枝鎖アルキリデン基であり、更に好適には、メチリデン、エチリデン又はプロピリデンである。

[置換基群 τ] の定義における「アラルキリデン基」は、上記「低級アルキリデン基」の1乃至3個の水素原子が上記「アリール基」で置き換えられた基であり、そのような基は、例えば、ベンジリデン、フェニルエチリデン、フェニルプロピリデン又はナフチルメチリデンであり得、好適には、フェニル若しくはナフチルで置換された炭素数1乃至4個の直鎖若しくは分枝鎖アルキリデン基であり、更に好適には、ベンジリデン又はフェニルエチリデンである。

「置換基群 $\alpha$ 」として定義された基のうち、好適な基の集合は「置換基群 $\alpha$ 」であり、これは、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、ハロゲノ低級アルコ

キシ基及び式 $-NR^*R^*$ を有する基(式中、 $R^*$ 及び $R^*$ の一方は水素原子又は低級アルキル基であり、他方は水素原子、低級アルキル基又はアラルキル基である。)からなる。

「置換基群 $\beta$ 」として定義された基のうち、好適な基の集合は、「置換基群 $\beta$ 1」であり、これは、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、ニトロ低級アルキル基、アミノ低級アルキル基、モノ(低級アルキル)アミノ低級アルキル基、ジ(低級アルキル)アミノ低級アルキル基及びモノ(アラルキル)アミノ低級アルキル基からなる。

「置換基群 $\beta$ 1」の定義における「ハロゲノ低級アルキル基」は、前記「低級アルキル基」の1個若しくは2個以上の水素原子が前記「ハロゲン原子」で置換された基であり、好適には炭素数1乃至4個のハロゲノアルキル基であり、更に好適には、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル、ジクロロメチル、ジブロモメチル、フルオロメチル、2,2,2ートリクロロエチル、2,2,2ートリフルオロエチル、2ープロモエチル、2ークロロエチル、2ーフルオロエチル又は2,2ージブロモエチルであり、より更に好適には、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、ジフルオロメチル又はフルオロメチルであり、最も好適には、トリフルオロメチルである。

「置換基群 $\beta^1$ 」の定義における「ヒドロキシ低級アルキル基」は、前記「低級アルキル基」の1個若しくは2個以上の水素原子が前記「水酸基」で置換された基であり、好適には炭素数1乃至4個のヒドロキシアルキル基であり、更に好適には、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル又は3-ヒドロキシプロピルである。

「置換基群 $\beta$ <sup>1</sup>」の定義における「二トロ低級アルキル基」は、前記「低級アルキル基」の1個若しくは2個以上の水素原子が二トロ基で置換された基であり、好適には炭素数1乃至4個の二トロアルキル基であり、更に好適には、ニトロメチル、2-ニトロエチル又は3-ニトロプロピルである。

「置換基群 $\beta$ <sup>1</sup>」の定義における「アミノ低級アルキル基」、「低級アルキル アミノ低級アルキル基」、「ジ(低級アルキル)アミノ低級アルキル基」及び「ア ラルキルアミノ低級アルキル基」は、前記「低級アルキル基」の1 個若しくは 2個以上の水素原子が式-NR°R°を有する基(式中、R°及びR°の一方は水素原子又は低級アルキル基であり、他方は水素原子、低級アルキル基又はアラルキル基である。)で置換された基であり、好適には、アルキル部分が炭素数1乃至4個のアルキルである基であり、更に好適には、アミノメチル、2ーアミノエチル、3ーアミノプロピル、メチルアミノメチル、2ー(メチルアミノ)エチル、3ー(メチルアミノ)プロピル、エチルアミノメチル、2ー(エチルアミノ)エチル、3ー(エチルアミノ)プロピル、ジメチルアミノメチル、2ー(ジメチルアミノ)エチル、3ー(ジメチルアミノ)プロピル、ジエチルアミノ)エチル、2ー(ジメチルアミノ)エチル、3ー(ジエチルアミノ)プロピル、ジエチルアミノ)プロピル、ベンジルアミノメチル、2ー(ベンジルアミノ)エチル又は3ー(ベンジルアミノ)プロピルである。

化合物(I)の「薬理上許容されるエステル又はその他の誘導体」は、本発明の化合物が有する官能基(例えば、水酸基、アミノ基、イミノ基、ヒドロキシアリール基など)を常法にしたがって、保護基などで修飾することによって得られる化合物であり、例えば、本発明の化合物が水酸基を有する場合、当該水酸基を「一般的保護基」又は「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」で保護することにより、そのような「薬理上許容されるエステル又はその他の誘導体」が得られる。

ここで、「一般的保護基」は、加水素分解、加水分解、電気分解、光分解のような化学的方法により開裂し得る保護基であり、好適には、ホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、ピバロイル、バレリル、イソバレリル、オクタノイル、ノナノイル、デカノイル、3-メチルノナノイル、8-メチルノナノイル、3-エチルオクタノイル、3,7-ジメチルオクタノイル、ウンデカノイル、ドデカノイル、トリデカノイル、テトラデカノイル、ペンタデカノイル、ヘキサデカノイル、1-メチルペンタデカノイル、14-メチルペンタデカノイル、13,13-ジメチルテトラデカノイル、ハプタデカノイル、15-メチルヘキサデカノイル、オクタデカノイル、1-メチルヘプタデカノイル、ノナデカノイル、アイコサノイル、ヘナイコサノイルのようなアルカノイル基、クロロアセチル、ジクロロアセチル、トリク

ロロアセチル、トリフルオロアセチルのようなハロゲン化アルキルカルボニル 基、メトキシアセチルのような低級アルコキシアルキルカルボニル基、アクリ ロイル、プロピオロイル、メタクリロイル、クロトノイル、イソクロトノイル、 (E)-2-メチル-2-プテノイルのような不飽和アルキルカルボニル基等 の「脂肪族アシル基」(好適には、炭素数1乃至6個の低級脂肪族アシル基で ある。) ; ベンゾイル、 $\alpha$  ーナフトイル、 $\beta$  ーナフトイルのようなアリールカル ボニル基、2-プロモベンゾイル、4-クロロベンゾイル、2,4,6-トリ フルオロベンゾイルのようなハロゲン化アリールカルボニル基、2,4,6-トリメチルベンゾイル、4ートルオイルのような低級アルキル化アリールカル ポニル基、4-アニソイルのような低級アルコキシ化アリールカルボニル基、 4-二トロペンゾイル、2-二トロベンゾイルのような二トロ化アリールカル ボニル基、2-(メトキシカルボニル)ベンゾイルのような低級アルコキシカ ルボニル化アリールカルボニル基、4-フェニルベンゾイルのようなアリール 化アリールカルボニル基等の「芳香族アシル基」;メトキシカルボニル、エト キシカルボニル、プロポキシカルボニル、プトキシカルボニル、sープトキシ カルボニル、tープトキシカルボニル、イソプトキシカルボニルのような低級 アルコキシカルボニル基、2,2,2-トリクロロエトキシカルボニル、2-トリメチルシリルエトキシカルボニルのようなハロゲン又はトリ低級アルキ ルシリル基で置換された低級アルコキシカルボニル基等の「アルコキシカルボ ニル基」; テトラヒドロピラン-2-イル、3-プロモテトラヒドロピラン-2-イル、4-メトキシテトラヒドロピラン-4-イル、テトラヒドロチオピ ラン-2-イル、4-メトキシテトラヒドロチオピラン-4-イルのような 「テトラヒドロピラニル又はテトラヒドロチオピラニル基」; テトラヒドロフ ラン-2-イル、テトラヒドロチオフラン-2-イルのような「テトラヒドロ フラニル又はテトラヒドロチオフラニル基」; トリメチルシリル、トリエチル シリル、イソプロピルジメチルシリル、t-ブチルジメチルシリル、メチルジ イソプロピルシリル、メチルジーt-プチルシリル、トリイソプロピルシリル. のようなトリ低級アルキルシリル基、ジフェニルメチルシリル、ジフェニルブ チルシリル、ジフェニルイソプロピルシリル、フェニルジイソプロピルシリル

のような1乃至2個のアリール基で置換されたトリ低級アルキルシリル基等 の「シリル基」:メトキシメチル、1,1-ジメチル-1-メトキシメチル、 エトキシメチル、プロポキシメチル、イソプロポキシメチル、ブトキシメチル、 t-プトキシメチルのような低級アルコキシメチル基、2-メトキシエトキシ メチルのような低級アルコキシ化低級アルコキシメチル基、2,2,2ートリ クロロエトキシメチル、ピス(2-クロロエトキシ)メチルのようなハロゲノ 低級アルコキシメチル等の「アルコキシメチル基」: 1 - エトキシエチル、1 - (イソプロポキシ) エチルのような低級アルコキシ化エチル基、2,2,2 ートリクロロエチルのようなハロゲン化エチル基等の「置換エチル基」; ベンジル、α-ナフチルメチル、β-ナフチルメチル、ジフェニルメチル、ト リフェニルメチル、α - ナフチルジフェニルメチル、9 - アンスリルメチルの ような1乃至3個のアリール基で置換された低級アルキル基、4ーメチルベン ジル、2、4、6-トリメチルベンジル、3、4、5-トリメチルベンジル、 4-メトキシベンジル、4-メトキシフェニルジフェニルメチル、2-ニトロ ペンジル、4-ニトロペンジル、4-クロロペンジル、4-プロモベンジル、 4-シアノベンジルのような低級アルキル、低級アルコキシ、ニトロ、ハロゲ ン、シアノ基でアリール環が置換された1乃至3個のアリール基で置換された 低級アルキル基等の「アラルキル基」: ピニルオキシカルボニル、アリルオキ シカルボニルのような「アルケニルオキシカルボニル基」: 又はベンジルオキ シカルボニル、4-メトキシベンジルオキシカルボニル、3,4-ジメトキシ ベンジルオキシカルボニル、2-ニトロベンジルオキシカルボニル、4-ニト ロベンジルオキシカルボニルのような、1 乃至 2 個の低級アルコキシ又はニト ロ基でアリール環が置換されていてもよい「アラルキルオキシカルボニル基」 である。

「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護基」は、人体内で加水分解等の生物学的方法により開裂し、フリーの酸又はその塩を生成する保護基であり、そのような誘導体か否かは、ラットやマウスのような実験動物に静脈注射により投与し、その後の動物の体液を調べ、元となる化合物又はその薬理学的に許容される塩を検出できることにより決定できる。

そのような「生体内で加水分解のような生物学的方法により開裂し得る保護 基」は、好適には、ホルミルオキシメチル、アセトキシメチル、ジメチルアミ ノアセトキシメチル、プロピオニルオキシメチル、ブチリルオキシメチル、ピ パロイルオキシメチル、バレリルオキシメチル、イソバレリルオキシメチル、 ヘキサノイルオキシメチル、1-ホルミルオキシエチル、1-アセトキシエチ ル、1ープロピオニルオキシエチル、1ープチリルオキシエチル、1ーピバロ イルオキシエチル、1 ーパレリルオキシエチル、1 ーイソバレリルオキシエチ ル、1-ヘキサノイルオキシエチル、1-ホルミルオキシプロピル、1-アセ トキシプロピル、1 - プロピオニルオキシプロピル、1 - プチリルオキシプロ ピル、1 - ピバロイルオキシプロピル、1 - バレリルオキシプロピル、1 - イ ソバレリルオキシプロピル、1 - ヘキサノイルオキシプロピル、1 - アセトキ シブチル、1 – プロピオニルオキシブチル、1 – ブチリルオキシブチル、1 – ピパロイルオキシプチル、1-アセトキシペンチル、1-プロピオニルオキシ ペンチル、1-プチリルオキシペンチル、1-ピバロイルオキシペンチル、1ーピパロイルオキシヘキシルのような1-(「低級脂肪族アシル」オキシ)「低 級アルキル基」、シクロペンチルカルボニルオキシメチル、シクロヘキシルカ ルボニルオキシメチル、1-シクロペンチルカルボニルオキシエチル、1-シ クロヘキシルカルボニルオキシエチル、1 – シクロペンチルカルボニルオキシ プロピル、1-シクロヘキシルカルボニルオキシプロピル、1-シクロペンチ ルカルボニルオキシブチル、1 – シクロヘキシルカルボニルオキシブチルのよ うな1-(「シクロアルキル」カルボニルオキシ)「低級アルキル基」、ペンゾ イルオキシメチルのような1- (「芳香族アシル」オキシ)「低級アルキル基」 等の1-(アシルオキシ)「低級アルキル基」;メトキシカルボニルオキシメチ ル、エトキシカルボニルオキシメチル、プロポキシカルボニルオキシメチル、 イソプロポキシカルボニルオキシメチル、ブトキシカルボニルオキシメチル、 イソプトキシカルボニルオキシメチル、ペンチルオキシカルボニルオキシメチ ル、ヘキシルオキシカルボニルオキシメチル、シクロヘキシルオキシカルボニ ルオキシメチル、シクロヘキシルオキシカルボニルオキシ (シクロヘキシル) メチル、1-(メトキシカルボニルオキシ) エチル、1-(エトキシカルボニ

ルオキシ) エチル、1 - (プロポキシカルボニルオキシ) エチル、1 - (イソ プロポキシカルボニルオキシ) エチル、1 - (プトキシカルボニルオキシ) エ チル、1-(イソプトキシカルボニルオキシ) エチル、1-(t-ブトキシカ ルボニルオキシ) エチル、1-(ペンチルオキシカルボニルオキシ) エチル、 1-(ヘキシルオキシカルポニルオキシ)エチル、1-(シクロペンチルオキ シカルボニルオキシ) エチル、1 - (シクロペンチルオキシカルボニルオキシ) プロピル、1 - (シクロヘキシルオキシカルボニルオキシ) プロピル、1 - (シ クロペンチルオキシカルボニルオキシ) プチル、1 - (シクロヘキシルオキシ カルボニルオキシ) プチル、1-(シクロヘキシルオキシカルボニルオキシ) エチル、1-(エトキシカルボニルオキシ)プロピル、1-(メトキシカルボ ニルオキシ) プロピル、1 - (エトキシカルボニルオキシ) プロピル、1 - (プ ロポキシカルボニルオキシ) プロピル、1 - (イソプロポキシカルボニルオキ シ) プロピル、1 - (プトキシカルボニルオキシ) プロピル、1 - (イソプト キシカルボニルオキシ)プロピル、1-(ペンチルオキシカルボニルオキシ) プロピル、1-(ヘキシルオキシカルボニルオキシ)プロピル、1-(メトキ シカルボニルオキシ) プチル、1 - (エトキシカルボニルオキシ) プチル、1 - (プロポキシカルボニルオキシ) プチル、1 - (イソプロポキシカルボニル、 オキシ) ブチル、1 - (ブトキシカルボニルオキシ) ブチル、1 - (イソブト キシカルポニルオキシ) プチル、1 - (メトキシカルポニルオキシ) ペンチル、 1-(エトキシカルボニルオキシ)ペンチル、1-(メトキシカルボニルオキ シ) ヘキシル、1-(エトキシカルボニルオキシ) ヘキシルのような (低級ア ルコキシカルボニルオキシ)アルキル基;(5-フェニル-2-オキソ-1, 3-ジオキソレン-4-イル)メチル、[5-(4-メチルフェニル)-2-オキソー1, 3ージオキソレンー4ーイル] メチル、[5-(4-メトキシフ ェニル) -2-オキソ-1, 3-ジオキソレン-4-イル] メチル、<math>[5-(4ーフルオロフェニル) -2-オキソ-1,3-ジオキソレン-4-イル]メチ ル、「5-(4-クロロフェニル)-2-オキソ-1,3-ジオキソレン-4 ーイル〕メチル、(2ーオキソー1,3-ジオキソレン-4-イル)メチル、 (5-メチル-2-オキソー1, 3-ジオキソレン-4-イル) メチル、(5

ーエチルー2ーオキソー1, 3ージオキソレンー4ーイル)メチル、(5ープロピルー2ーオキソー1, 3ージオキソレンー4ーイル)メチル、(5ーイソプロピルー2ーオキソー1, 3ージオキソレンー4ーイル)メチル、(5ーブチルー2ーオキソー1, 3ージオキソレンー4ーイル)メチルのようなオキソジオキソレニルメチル基;等の「カルボニルオキシアルキル基」:フタリジル、ジメチルフタリジル、ジメトキシフタリジルのような「フタリジル基」:前記「低級脂肪族アシル基」:前記「芳香族アシル基」:「コハク酸のハーフエステル塩残基」:「アミノ酸等のエステル形成残基」:カルバモイル基:1乃至2個の低級アルキル基で置換されたカルバモイル基:又はピバロイルオキシメチルオキシカルボニルのような「1ー(アシルオキシ)アルキルオキシカルボニル基」であり得、好適には、「カルボニルオキシアルキル基」である。

また、本発明の化合物(I)がアミノ基、イミノ基及び/又はヒドロキシアリール基を有する場合にも、当該官能基を修飾することにより、「誘導体」にすることができる。そのような誘導体は、例えば、化合物(I)が有するアミノ基、イミノ基及び/又はスルホンアミド基の窒素原子に、前記「脂肪族アシル基」又は前記「芳香族アシル基」が結合しているアミド誘導体である。

「その薬理上許容される塩」は、本発明の化合物 (I)、その薬理上許容されるエステル又はその他の誘導体は、アミノ基のような塩基性の基を有する場合には酸と反応させることにより、又、ヒドロキシアリール基のような酸性基を有する場合には塩基と反応させることにより、塩にすることができるので、その塩を示す。

塩基性基に基づく塩は、好適には、塩酸塩、臭化水素酸塩、沃化水素酸塩のようなハロゲン化水素酸塩、硝酸塩、過塩素酸塩、硫酸塩、燐酸塩等の無機酸塩;メタンスルホン酸塩、トリフルオロメタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩のような低級アルカンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、pートルエンスルホン酸塩のようなアリールスルホン酸塩、酢酸塩、りんご酸塩、フマール酸塩、コハク酸塩、クエン酸塩、アスコルビン酸塩、酒石酸塩、蓚酸塩、マレイン酸塩等の有機酸塩;又はグリシン塩、リジン塩、アルギニン塩、オルニ

チン塩、グルタミン酸塩、アスパラギン酸塩のようなアミノ酸塩である。

一方、酸性基に基づく塩は、好適には、ナトリウム塩、カリウム塩、リチウム塩のようなアルカリ金属塩、カルシウム塩、マグネシウム塩のようなアルカリ土類金属塩、アルミニウム塩、鉄塩等の金属塩;アンモニウム塩のような無機塩、tーオクチルアミン塩、ジベンジルアミン塩、モルホリン塩、グルコサミン塩、フェニルグリシンアルキルエステル塩、エチレンジアミン塩、Nーメチルグルカミン塩、グアニジン塩、ジエチルアミン塩、トリエチルアミン塩、ジシクロヘキシルアミン塩、N, N'ージベンジルエチレンジアミン塩、クロロプロカイン塩、プロカイン塩、ジエタノールアミン塩、Nーベンジルフェネチルアミン塩、ピペラジン塩、テトラメチルアンモニウム塩、トリス(ヒドロキシメチル)アミノメタン塩のような有機塩等のアミン塩;又はグリシン塩、リジン塩、アルギニン塩、オルニチン塩、グルタミン酸塩、アスパラギン酸塩のようなアミノ酸塩である。

本発明の一般式(I)を有する化合物又はその薬理上許容される塩、エステル若しくはその他の誘導体は、大気中に放置したり、又は、再結晶をすることにより、水分を吸収し、吸着水が付いたり、水和物となる場合があり、そのような水和物も本発明に包含される。

本発明の一般式(I)を有する化合物には、幾何異性体(シスートランス異性体或いは Z - E 異性体)及び分子内の不斉中心に基づく光学異性体等が存在する場合がある。本発明の化合物においては、これらの異性体およびこれらの異性体の混合物がすべて単一の式、即ち一般式(I)で示されているが、本発明はこれらの異性体およびこれらの異性体の任意の割合の混合物をもすべて含むものである。

上記一般式(I)を有する化合物は、好適には、表1乃至表20に示す化合物である。なお、表1乃至表20の化合物は、それぞれ化合物(I-1)乃至化合物(I-20)の式を有する。

表 
$$1$$
 $R^2$ 
 $R^3$ 
 $R$ 
 $H$ 
 $(I-1)$ 

化合物番 号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
1-1	Ph	4-Pyr	3-Pip
1-2	Ph	4-Pyr	4-Pip
1-3	Ph	4-Pyr	4-(3, 4-deH-Pip)
1-4	Ph	4-Pyr	1-Me-4-Pip
1-5	Ph	4-Pyr	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-6	Ph	4-Pyr	1-Et-4-Pip
1-7	Ph	4-Pyr	1-Bn-4-Pip
1-8	4-F-Ph	4-Pyr	3-Pip
1-9	4-F-Ph	4-Pyr	4-Pip
1-10	4-F-Ph	4-Pyr	4-(3,4-deH-Pip)
1-11	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-4-Pip
1-12	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-13	4-F-Ph	4-Pyr	1-Et-4-Pip
1-14	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bn-4-Pip
1-15	3-F-Ph	4-Pyr	3- <b>P</b> ip
1-16	3-F-Ph	4-Pyr	4-Pip
l-17	3-F-Ph	4-Pyr	4-(3, 4-deH-Pip)
l <b>-1</b> 8	3-F-Ph	4-Pyr	1-Me-4-Pip
-19	3-F-Ph	4-Pyr	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
-20	3-F-Ph	4-Pyr	1-Et-4-Pip
-21	3-F-Ph	4-Pyr	1-Bn-4-Pip
-22	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	3-Pip
-23	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	4-Pip
-24	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	4-(3, 4-deH-Pip)
-25	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	1-Me-4-Pip
-26	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)

1-27	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	1-Et-4-Pip
1-28	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	1-Bn-4-Pip
1-29	3-C1-Ph	4-Pyr	3-Pip
1-30	3-C1-Ph	4-Pyr	4-Pip
1-31	3-C1-Ph	4-Pyr	4-(3,4-deH-Pip)
1-32	3-C1-Ph	4-Pyr	1-Me-4-Pip
1-33	3-C1-Ph	4-Pyr	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-34	3-C1-Ph	4-Pyr	1-Et-4-Pip
1-35	. 3-C1-Ph	4-Pyr	1-Bn-4-Pip
1-36	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Pip
1-37	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-Pip
1-38	Ph ·	$2-NH_2-4-Pym$	4-(3,4-deH-Pip)
1-39	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-Pip
1-40	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-41	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Et-4-Pip
1-42	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bn-4-Pip
1-43	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Pip
1-44	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-Pip
1-45	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-(3,4-deH-Pip)
1-46	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-Pip
1-47	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-48	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-Et-4-Pip
1-49	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bn-4-Pip
1-50	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3- <b>P</b> ip
1-51	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-Pip
1-52	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-(3,4-deH-Pip)
1-53	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-Pip
1-54	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-55	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Et-4-Pip
1-56	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bn-4-Pip
1-57	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Pip
1-58	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-Pip
1-59	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-(3,4-deH-Pip)
1-60	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-Pip
1-61	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-62	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Et-4-Pip

1-63	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bn-4-Pip
1-64	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Pip
1-65	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-Pip
1-66	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-(3,4-deH-Pip)
1-67	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-Pip
1-68	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-69	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Et-4-Pip
1-70	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bn-4-Pip
1-71	Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Pip
1-72	Ph	2-MeNH-4-Pym	4-Pip
1-73	Ph	2-MeNH-4-Pym	4-(3, 4-deH-Pip)
1-74	Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-Pip
1-75	Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-76	Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-4-Pip
1-77	Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bn-4-Pip
1-78	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Pip
1-79	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-Pip
1-80	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-(3,4-deH-Pip)
1-81	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-Pip
1-82	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-83	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-4-Pip
1-84	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bn-4-Pip
1-85	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Pip
1-86	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-P i p
1-87	3-F-Ph.	2-MeNH-4-Pym	4-(3, 4-deH-Pip)
1-88	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-Pip
1-89	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-90	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-4-Pip
1-91	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bn-4-Pip
1-92	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Pip
1-93	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-Pip
1-94	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-(3, 4-deH-Pip)
1-95	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-Pip
1-96	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-97	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-4-Pip
1-98	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bn-4-Pip

1-99	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Pip
1-100	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-Pip
1-101	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-(3,4-deH-Pip)
1-102	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-Pip
1-103	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-104	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	· 1-Et-4-Pip
1-105	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bn-4-Pip
1-106	3-C1-4-F-Ph	4-Pyr	4-Pip
1-107	3-C1-4-F-Ph	4-Pyr	4-(3, 4-deH-Pip)
1-108	3-C1-4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-4-Pip
1-109	3-C1-4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-110	3, 4, 5-triF-Ph	4-Pyr	4-Pip
1-111	3, 4, 5-triF-Ph	4-Pyr	4-(3,4-deH-Pip)
1-112	3, 4, 5-triF-Ph	4-Pyr	1-Me-4-Pip
1-113	3, 4, 5-triF-Ph	4-Pyr	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-114	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	4-Pip
1-115	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	4-(3, 4-deH-Pip)
1-116	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	1-Me-4-Pip
1-117	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-118	3-CHF <sub>2</sub> O-Ph	4-Pyr	4-Pip
1-119	3-CHF <sub>2</sub> O-Ph	4-Pyr	4-(3, 4-deH-Pip)
1-120	3-CHF <sub>2</sub> O-Ph	4-Pyr	1-Me-4-Pip
1-121	3-CHF <sub>2</sub> O-Ph	4-Pyr	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-122	3-C1-4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-Pip
1-123	3-C1-4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-(3, 4-deH-Pip)
1-124	3-C1-4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-Pip
1-125	3-C1-4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-126	3, 4, 5-triF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-Pip
1-127	3, 4, 5-triF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-(3, 4-deH-Pip)
1-128	3, 4, 5-triF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-Pip
1-129	3, 4, 5-triF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-130	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-Pip
1-131	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-(3, 4-deH-Pip)
1-132	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-Pip
1-133	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-134	3-CHF <sub>2</sub> O-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-Pip

1 –			
, 135	$3-CHF_2O-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	4-(3, 4-deH-Pip)
, 136	3-CHF <sub>2</sub> O-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-Pip
. 137	$3-CHF_2O-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-138	3-C1-4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-Pip
,-139	3-C1-4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-(3, 4-deH-Pip)
1-140	3-C1-4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-Pip
1-141	3-C1-4-P-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
l-142	3, 4, 5-triF-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-Pip
1-143	3, 4, 5-triF-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-(3, 4-deH-Pip)
1-144	3, 4, 5-triF-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-Pip
1-145	3, 4, 5-triF-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-146	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	4-Pip
1-147	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	4-(3, 4-deH-Pip)
1-148	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-Pip
1-149	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-150	3-CHF <sub>2</sub> 0-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-Pip
1-151	3-CHF <sub>2</sub> 0-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-(3, 4-deH-Pip)
1-152	3-CHF <sub>2</sub> 0-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-Pip
1-153	3-CHF <sub>2</sub> 0-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-154	Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	4-Pip
1-155	Ph	$2-NH_z-4-Pyr$	4-(3, 4-deH-Pip)
1-156	Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-4-Pip
1-157	Ph	$2-NH_z-4-Pyr$	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-158	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	4-Pip
1-159	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	4-(3,4-deH-Pip)
1-160	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-4-Pip
1-161	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-162	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	4-Pip
1-163	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	4-(3, 4-deH-Pip)
1-164	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-4-Pip
1-165	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-166	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	4-Pip
1-167	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	4-(3, 4-deH-Pip)
1-168	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-4-Pip
1-169	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-170	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	4-Pip

1-171	3-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pyr	4-(3,4-deH-Pip)
1-172	3-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pyr	1-Me-4-Pip
1-173	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-174	Ph	2-MeNH-4-Pyr	4-Pip
1-175	Ph	2-MeNH-4-Pyr	4-(3,4-deH-Pip)
1-176	Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-4-Pip
1-177	Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-178	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	4-Pip
1-179	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	4-(3, 4-deH-Pip)
1-180	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-4-Pip
1-181	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-182	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	4-Pip
1-183	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	4-(3,4-deH-Pip)
1-184	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-4-Pip
1-185	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-186	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pyr	4-Pip
1-187	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pyr	4-(3,4-deH-Pip)
1-188	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-4-Pip
1-189	3, 4-d i F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-190	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pyr	4-Pip
1-191	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pyr	4-(3,4-deH-Pip)
1-192	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-4-Pip
1-193	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-194	Ph ·	4-Pym	4-Pip
1-195	Ph	4-Pym	4-(3, 4-deH-Pip)
1-196	Ph	4-Pym	1-Me-4-Pip
1-197	Ph	4-Pym	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-198	4-F-Ph	4-Pym	4-Pip
1-199	4-F-Ph	4-Pym	4-(3,4-deH-Pip)
1-200	4-F-Ph	4-Pym	1-Me-4-Pip
1-201	4-F-Ph	4-Pym	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-202	3-F-Ph	4-Pym	4-Pip
1-203	3-F-Ph	4-Pym	4-(3, 4-deH-Pip)
1-204	3-F-Ph	4-Pym	1-Me-4-Pip
1-205	3-F-Ph	4-Pym	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-206	3,4-diF-Ph	4-Pym	4-Pip

1-207	3, 4-diF-Ph	4-Pym	4-(3,4-deH-Pip)
1-208	3, 4-diF-Ph	4-Pym	1-Me-4-Pip
1-209	3,4-diF-Ph	4-Pym	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-210	3-C1-Ph	4-Pym	4-Pip
1-211	3-C1-Ph	4-Pym	4-(3,4-deH-Pip)
1-212	3-C1-Ph	4-Pym	1-Me-4-Pip
1-213	3-C1-Ph	4-Pym	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-214	Ph	2-MeO-4-Pym	4-Pip
1-215	Ph	2-MeO-4-Pym	4-(3,4-deH-Pip)
1-216	Ph	2-MeO-4-Pym	1-Me-4-Pip
1-217	Ph	2-MeO-4-Pym	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-218	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	4-Pip
1-219	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	4-(3,4-deH-Pip)
1-220	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	1-Me-4-Pip
1-221	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-222	3-F-Ph	2-MeO-4-Pym	4-Pip
1-223	3-F-Ph	2-MeO-4-Pym	4-(3, 4-deH-Pip)
1-224	3-F-Ph	2-MeO-4-Pym	1-Me-4-Pip
1-225	3-F-Ph	2-MeO-4-Pym	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-226	3, 4-diF-Ph	2-Me0-4-Pym	4-Pip
1-227	3, 4-diF-Ph	2-MeO-4-Pym	4-(3, 4-deH-Pip)
1-228	3, 4-diF-Ph	2-MeO-4-Pym	1-Me-4-Pip
1-229	3, 4-diF-Ph	2-MeO-4-Pym	1-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-230	3-C1-Ph	2-Me0-4-Pym	4-Pip
1-231	3-C1-Ph	2-Me0-4-Pym	4-(3, 4-deH-Pip)
1-232	3-C1-Ph	2-MeO-4-Pym	1-Me-4-Pip
1-233	3-C1-Ph	2-MeO-4-Pym	1-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-234	4-F-Ph	4-Pyr	2-Me-4-Pip
1-235	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2, 6, 6-tetraMe-4-Pip
1-236	4-F-Ph	4-Pyr	1-Ac-4-Pip
1-237	4-F-Ph	4-Pyr	1-Ac-4-(3, 4-deH-Pip)
1-238	4-F-Ph	4-Pyr	4-0H-4-Pip
1-239	4-F-Ph	4-Pyr	4-0H-1-Me-4-Pip
1-240	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Me-4-Pip
1-241	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2, 6, 6-tetraMe-4-Pip
1-242	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Ac-4-Pip
	•	·	

1-243	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Ac-4-(3, 4-deH-Pip)
1-244	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-0H-4-Pip
1-245	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	4-OH-1-Me-4-Pip
1-246	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Me-4-Pip
1-247	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2, 6, 6-tetraMe-4-Pip
1-248	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Ac-4-Pip
1-249	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Ac-4-(3, 4-deH-Pip)
1-250	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-0H-4-Pip
1-251	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	4-0H-1-Me-4-Pip
1-252	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	4-Pip
1-253	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	4-(3, 4-deH-Pip)
1-254	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	4-Pip
1-255	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	4-(3, 4-deH-Pip)
1-256	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	4-Pip
1-257	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	4-(3,4-deH-Pip)
1-258	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	4-Pip
1-259	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	4-(3, 4-deH-Pip)
1-260	3-C1-Ph	2-BnNH-4-Pyr	4-Pip
1-261	3-C1-Ph	2-BnNH-4-Pyr	4-(3,4-deH-Pip)
1-262	3-Cl-Ph	2-BnNH-4-Pym	4-Pip
1-263	3-C1-Ph	2-BnNH-4-Pym	4-(3,4-deH-Pip)
1-264	3-C1-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	4-Pip
1-265	3-C1-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	4-(3,4-deH-Pip)
1-266	3-C1-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	4-Pip
1-267	3-C1-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	4-(3, 4-deH-Pip)
1-268	3-CF <sub>8</sub> -Ph	2-BnNH-4-Pyr	4-Pip
1-269	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-BnNH-4-Pyr	4-(3, 4-deH-Pip)
1-270	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-BnNH-4-Pym	4-Pip
1-271	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-BnNH-4-Pym	4-(3, 4-deH-Pip)
1-272	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	4-Pip
1-273	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	4-(3, 4-deH-Pip)
1-274	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	4-Pip
1-275	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	4-(3, 4-deH-Pip)

# 号  1-276	// A 11-60	n!	n 9	
1-277	化合物番 号	R¹	R²	R <sup>3</sup>
1-278	1-276	4-F-Ph	4-Pyr	3-(3, 4-deH-Pip)
1-279	1-277	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-3-(3,4-deH-Pip)
1-280 4-F-Ph 4-Pyr 1-Fr-4-Pip 1-281 4-F-Ph 4-Pyr 1-iPr-4-Qip 1-282 4-F-Ph 4-Pyr 1-iPr-4-Pip 1-283 4-F-Ph 4-Pyr 1-iBu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-284 4-F-Ph 4-Pyr 1-iBu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-285 4-F-Ph 4-Pyr 1-Hx-4-(3, 4-deH-Pip) 1-286 4-F-Ph 4-Pyr 1-Hx-4-(3, 4-deH-Pip) 1-287 4-F-Ph 4-Pyr 1-Hx-4-(3, 4-deH-Pip) 1-288 4-F-Ph 4-Pyr 1-Mn-4-(3, 4-deH-Pip) 1-289 4-F-Ph 4-Pyr 1-Nn-4-(3, 4-deH-Pip) 1-290 4-F-Ph 4-Pyr 1-CPr-4-(3, 4-deH-Pip) 1-291 4-F-Ph 4-Pyr 1-CHx-4-(3, 4-deH-Pip) 1-292 4-F-Ph 4-Pyr 1-Bn-4-(3, 4-deH-Pip) 1-293 4-F-Ph 4-Pyr 1-Bn-4-(3, 4-deH-Pip) 1-294 4-F-Ph 4-Pyr 1-Bn-4-(3, 4-deH-Pip) 1-295 4-F-Ph 4-Pyr 1-Mn-4-(3, 4-deH-Pip) 1-296 4-F-Ph 4-Pyr 1-Mn-4-(3, 4-deH-Pip) 1-297 4-F-Ph 4-Pyr 1-Bn-4-(3, 4-deH-Pip) 1-298 4-F-Ph 4-Pyr 1-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-299 4-F-Ph 4-Pyr 1-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-299 4-F-Ph 4-Pyr 1-Rlyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-300 4-F-Ph 4-Pyr 1-Rlyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-301 4-F-Ph 4-Pyr 1-Qlyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-302 4-F-Ph 4-Pyr 1-Qlyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-303 4-F-Ph 4-Pyr 1-Qlyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-304 4-F-Ph 4-Pyr 1-Qlyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-305 4-F-Ph 4-Pyr 7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind) 1-306 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 7, 9a-hexaH-2H-Qui) 1-306 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui)	1-278	4-F-Ph	4-Pyr	1-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-281 4-F-Ph 4-Pyr 1-iPr-4-(3, 4-deH-Pip) 1-282 4-F-Ph 4-Pyr 1-iBu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-283 4-F-Ph 4-Pyr 1-iBu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-284 4-F-Ph 4-Pyr 1-iBu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-285 4-F-Ph 4-Pyr 1-Hx-4-(3, 4-deH-Pip) 1-286 4-F-Ph 4-Pyr 1-Hx-4-(3, 4-deH-Pip) 1-287 4-F-Ph 4-Pyr 1-Hx-4-(3, 4-deH-Pip) 1-288 4-F-Ph 4-Pyr 1-Oc-4-(3, 4-deH-Pip) 1-289 4-F-Ph 4-Pyr 1-Oc-4-(3, 4-deH-Pip) 1-290 4-F-Ph 4-Pyr 1-cPr-4-(3, 4-deH-Pip) 1-291 4-F-Ph 4-Pyr 1-cHx-4-(3, 4-deH-Pip) 1-292 4-F-Ph 4-Pyr 1-gh-4-(3, 4-deH-Pip) 1-293 4-F-Ph 4-Pyr 1-gh-4-(3, 4-deH-Pip) 1-294 4-F-Ph 4-Pyr 1-gh-4-(3, 4-deH-Pip) 1-295 4-F-Ph 4-Pyr 1-(3-Ph-Pr)-4-(3, 4-deH-Pip) 1-296 4-F-Ph 4-Pyr 1-(4-Ph-Bu)-4-(3, 4-deH-Pip) 1-297 4-F-Ph 4-Pyr 1-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-298 4-F-Ph 4-Pyr 1-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-299 4-F-Ph 4-Pyr 1-Rlyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-300 4-F-Ph 4-Pyr 1-2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-(3, 4-deH-Pip) 1-301 4-F-Ph 4-Pyr 1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-(3, 4-deH-Pip) 1-302 4-F-Ph 4-Pyr 7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind) 1-303 4-F-Ph 4-Pyr 7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind) 1-305 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui) 1-306 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui)	1-279	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-282	1-280	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr-4-Pip
1-283	1-281	4-F-Ph	4-Pyr	1-iPr-4-(3,4-deH-Pip)
1-284	1-282	4-F-Ph	4-Pyr	1-iPr-4-Pip
1-285	1-283	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-286	1-284	4-F-Ph	4-Pyr	1-tBu-4-(3,4-deH-Pip)
1-287	1-285	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-288	1-286	4-F-Ph	4-Pyr	1-Hx-4-(3, 4-deH-Pip)
1-289	1-287	4-F-Ph	4-Pyr	1-Hp-4-(3, 4-deH-Pip)
1-290	1-288	4-F-Ph	4-Pyr	1-0c-4-(3, 4-deH-Pip)
1-291	1-289	4-F-Ph	4-Pyr	1-Nn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-292 4-F-Ph 4-Pyr 1-CHx-4-(3, 4-deH-Pip) 1-293 4-F-Ph 4-Pyr 1-Bn-4-(3, 4-deH-Pip) 1-294 4-F-Ph 4-Pyr 1-Phet-4-(3, 4-deH-Pip) 1-295 4-F-Ph 4-Pyr 1-(3-Ph-Pr)-4-(3, 4-deH-Pip) 1-296 4-F-Ph 4-Pyr 1-(4-Ph-Bu)-4-(3, 4-deH-Pip) 1-297 4-F-Ph 4-Pyr 1-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-298 4-F-Ph 4-Pyr 1-Propargyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-299 4-F-Ph 4-Pyr 2, 2, 6, 6, -tetraMe-4-(3, 4-deH-Pip) 1-300 4-F-Ph 4-Pyr 1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-(3, 4-deH-Pip) 1-301 4-F-Ph 4-Pyr 1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-(3, 4-deH-Pip) 1-302 4-F-Ph 4-Pyr 1, 2, 2, 6, 8-pentaMe-4-Pip) 1-303 4-F-Ph 4-Pyr 7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind) 1-304 4-F-Ph 4-Pyr 7-octaH-Ind 1-305 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 7, 9a-hexaH-2H-Qui) 1-306 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui)	1-290	4-F-Ph	4-Pyr	1-cPr-4-(3,4-deH-Pip)
1-293	1-291	4-F-Ph	4-Pyr	1-cPn-4-(3,4-deH-Pip)
1-294	1-292	4-F-Ph	4-Pyr	1-cHx-4-(3, 4-deH-Pip)
1-295	1-293	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-296	1-294	4-F-Ph	· 4-Pyr	1-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-297 4-F-Ph 4-Pyr 1-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-298 4-F-Ph 4-Pyr 1-Propargyl-4-(3, 4-deH-Pip) 1-299 4-F-Ph 4-Pyr 2, 2, 6, 6, -tetraMe-4-(3, 4-deH-Pip) 1-300 4-F-Ph 4-Pyr 1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-(3, 4-deH-Pip) 1-301 4-F-Ph 4-Pyr 1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-Pip) 1-302 4-F-Ph 4-Pyr 7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind) 1-303 4-F-Ph 4-Pyr 7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind) 1-304 4-F-Ph 4-Pyr 7-octaH-Ind 1-305 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 7, 9a-hexaH-2H-Qui) 1-306 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui)	1-295	4-F-Ph	4-Pyr	1-(3-Ph-Pr)-4-(3, 4-deH-Pip)
1-298	1-296	4-F-Ph	4-Pyr	1-(4-Ph-Bu)-4-(3, 4-deH-Pip)
1-299 4-F-Ph 4-Pyr 2, 2, 6, 6, -tetraMe-4-(3, 4-deH-Pip) 1-300 4-F-Ph 4-Pyr 1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-(3, 4-deH-Pip) 1-301 4-F-Ph 4-Pyr 1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-Pip) 1-302 4-F-Ph 4-Pyr 7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind) 1-303 4-F-Ph 4-Pyr 7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind) 1-304 4-F-Ph 4-Pyr 7-octaH-Ind 1-305 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 7, 9a-hexaH-2H-Qui) 1-306 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui)	1-297	4-F-Ph	4-Pyr	1-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip)
1-300 4-F-Ph 4-Pyr 1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-(3, 4-deH-Pip) 1-301 4-F-Ph 4-Pyr 1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-Pip) 1-302 4-F-Ph 4-Pyr 7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind) 1-303 4-F-Ph 4-Pyr 7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind) 1-304 4-F-Ph 4-Pyr 7-octaH-Ind 1-305 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 7, 9a-hexaH-2H-Qui) 1-306 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui)	1-298	4-F-Ph	4-Pyr	1-Propargyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-300 4-F-Ph 4-Pyr 1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-(3, 4-deH-Pip) 1-301 4-F-Ph 4-Pyr 1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-Pip) 1-302 4-F-Ph 4-Pyr 7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind) 1-303 4-F-Ph 4-Pyr 7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind) 1-304 4-F-Ph 4-Pyr 7-octaH-Ind 1-305 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 7, 9a-hexaH-2H-Qui) 1-306 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui)	1-299	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2, 6, 6, -tetraMe-4-(3, 4-deH-Pip)
1-301 4-F-Ph 4-Pyr 1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-Pip) 1-302 4-F-Ph 4-Pyr 7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind) 1-303 4-F-Ph 4-Pyr 7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind) 1-304 4-F-Ph 4-Pyr 7-octaH-Ind 1-305 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 7, 9a-hexaH-2H-Qui) 1-306 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui)	1-300	4-F-Ph	4-Pyr	1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-(3, 4-deH-Pip)
1-303	1-301	4-F-Ph	4-Pyr	
1-304	1-302	4-F-Ph	4-Pyr	7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind)
1-304 4-F-Ph 4-Pyr 7-octaH-Ind 1-305 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 7, 9a-hexaH-2H-Qui) 1-306 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui)	1-303	4-F-Ph	4-Pyr	7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind)
1-306 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui)	1-304	4-F-Ph	4-Pyr	·
1-306 4-F-Ph 4-Pyr 8-(1,3,4,6,9,9a-hexaH-2H-Qui)	l <b>–30</b> 5	4-F-Ph	4-Pyr	8-(1, 3, 4, 6, 7, 9a-hexaH-2H-Qui)
1 007	-306	4-F-Ph	4-Pyr	- · · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
,	-307	4-F-Ph	4-Pyr	

1-308	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diMe-4-(3, 4-deH-PiP)
1-309	4-F-Ph	4-Pyr	1, 2, 2-triMe-4-(3, 4-deH-PiP)
1-310	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diMe-4-(4, 5-deH-PiP)
1-311	4-F-Ph	4-Pyr	1, 2, 2-triMe-4-(4, 5-deH-PiP)
1-312	4-F-Ph	4-Pyr .	2,6-diMe-4-(3,4-deH-PiP),
1-313	4-F-Ph	4-Pyr	1, 2, 6-triMe-4-(3, 4-deH-PiP)
1-314	4-F-Ph	4-Pyr	2-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-315	4-F-Ph	4-Pyr	1,2-diMe-4-(3,4-deH-Pip)
1-316	4-F-Ph	4-Pyr	1-Et-2-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-317	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr-2-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-318	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bu-2-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-319	4-F-Ph	4-Pyr	1-Phet-2-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-320	4-F-Ph	4-Pyr	2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-321	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-322	4-F-Ph	4-Pyr	1,2-diEt-4-(3,4-deH-Pip)
1-323	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-324	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bu-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-325	4-F-Ph	4-Pyr	1-Phet-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-326	4-F-Ph	4-Pyr	2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-327	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-2-Pr-4-(3,4-deH-Pip)
1-328	4-F-Ph	4-Pyr	1-Et-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-329	4-F-Ph	4-Pyr	1, 2-diPr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-330	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bu-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-331	4-F-Ph	4-Pyr	1-Phet-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-332	4-F-Ph	4-Pyr	2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-333	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-334	4-F-Ph	4-Pyr	1-Et-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-335	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-336	4-F-Ph	4-Pyr	1,2-diBu-4-(3,4-deH-Pip)
1-337	4-F-Ph	4-Pyr	1-Phet-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-338	4-F-Ph	4-Pyr	2-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip)
1-339	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-2-Ally1-4-(3,4-deH-Pip)
1-340	4-F-Ph	4-Pyr	1-Et-2-Ally1-4-(3,4-deH-Pip)
1-341	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr-2-Ally1-4-(3,4-deH-Pip)
1-342	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bu-2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-343	4-F-Ph	4-Pyr	1-Phet-2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)

1-344	4-F-Ph	4-Pyr	2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-345	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-2-Bn-4-(3,4-deH-Pip)
1-346	4-F-Ph	4-Pyr	1-Et-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-347	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr-2-Bn-4-(3,4-deH-Pip)
1-348	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bu-2-Bn-4-(3,4-deH-Pip)
1-349	4-F-Ph	4-Pyr	1-Phet-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-350	4-F-Ph	4-Pyr	2-Phet-4-(3,4-deH-Pip)
1-351	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-352	4-F-Ph	4-Pyr	1-Et-2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-353	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr-2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-354	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bu-2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-355	4-F-Ph	4-Pyr	1,2-diPhet-4-(3,4-deH-Pip)
1-356	4-F-Ph	4-Pyr	2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-357	4-F-Pḥ	4-Pyr	1,2-diMe-4-(4,5-deH-Pip)
1-358	4-F-Ph	4-Pyr	1-Et-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-359	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-360	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bu-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-361	4-F-Ph	4-Pyr	1-Phet-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-362	4-F-Ph	4-Pyr	2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
1-363	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
1-364	4-F-Ph	4-Pyr	1,2-diEt-4-(4,5-deH-Pip)
1-365	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr-2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
1-366	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bu-2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
1-367	4-F-Ph	4-Pyr	1-Phet-2-Et-4-(4, 5-deH-Pip)
1-368	4-F-Ph	4-Pyr	2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-369	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-370	4-F-Ph	4-Pyr	1-Et-2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-371	4-F-Ph	4-Pyr	1,2-diPr-4-(4,5-deH-Pip)
1-372	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bu-2-Pr-4-(4, 5-deH-Pip)
1-373	4-F-Ph	4-Pyr	1-Phet-2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-374	4-F-Ph	4-Pyr	2-Bu-4-(4, 5-deH-Pip)
1-375	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-2-Bu-4-(4,5-deH-Pip)
1-376	4-F-Ph	4-Pyr	1-Et-2-Bu-4-(4,5-deH-Pip)
1-377	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr-2-Bu-4-(4,5-deH-Pip)
1-378	4-F-Ph	4-Pyr	1, 2-diBu-4-(4, 5-deH-Pip)
1-379	4-F-Ph	4-Pyr	1-Phet-2-Bu-4-(4, 5-deH-Pip)

1-380	4-F-Ph	4-Pyr	2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-381	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-382	4-F-Ph	4-Pyr	1-Et-2-Ally1-4-(4,5-deH-Pip)
1-383	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr-2-Allyl-4-(4, 5-deH-Pip)
1-384	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bu-2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-385	4-F-Ph	4-Pyr	1-Phet-2-Ally1-4-(4,5-deH-Pip)
1-386	4-F-Ph	4-Pyr	2-Bn-4-(4, 5-deH-Pip)
1-387	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)
1-388	4-F-Ph	4-Pyr	1-Et-2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)
1-389	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr-2-Bn-4-(4, 5-deH-Pip)
1-390	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bu-2-Bn-4-(4, 5-deH-Pip)
1-391	4-F-Ph	4-Pyr	1-Phet-2-Bn-4-(4, 5-deH-Pip)
1-392	4-F-Ph	4-Pyr	2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-393	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me-2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-394	4-F-Ph	4-Pyr	1-Et-2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-395	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr-2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-396	4-F-Ph	4-Pyr	1-Bu-2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-397	4-F-Ph	4-Pyr	1, 2-diPhet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-398	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-(3, 4-deH-Pip)
1-399	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-3-(3, 4-deH-Pip)
1-400	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-401	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-402	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pr-4-Pip
1-403	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-iPr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-404	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-iPr-4-Pip
1-405	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-406	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-tBu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-407	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-408	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Hx-4-(3,4-deH-Pip)
1-409	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Hp-4-(3, 4-deH-Pip)
1-410	4-P-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-0c-4-(3,4-deH-Pip)
1-411	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Nn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-412	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-cPr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-413	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-cPn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-414	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-cHx-4-(3, 4-deH-Pip)
1-415	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bn-4-(3,4-deH-Pip)

1-416	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-Phet-4-(3,4-deH-Pip)
1-417	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-(3-Ph-Pr)-4-(3, 4-deH-Pip)
1-418	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-(4-Ph-Bu)-4-(3, 4-deH-Pip)
1-419	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-420	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-Propargyl-4-(3, 4-deH-Pip)
1-421	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2, 2, 6, 6, -tetraMe-4-(3, 4-deH-Pip)
1-422	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-(3, 4-deH-Pip)
1-423	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-Pip)
1-424	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind)
1-425	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind)
1-426	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	7-octaH-Ind
1-427	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-(1, 3, 4, 6, 7, 9a-hexaH-2H-Qui)
1-428	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui)
1-429	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	8-octaH-Qui
1-430	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2,2-diMe-4-(3,4-deH-PiP)
1-431	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1, 2, 2-triMe-4-(3, 4-deH-PiP)
1-432	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2,2-diMe-4-(4,5-deH-PiP)
1-433	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1, 2, 2-triMe-4-(4, 5-deH-PiP)
1-434	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2,6-diMe-4-(3,4-deH-PiP)
1-435	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1, 2, 6-triMe-4-(3, 4-deH-PiP)
1-436	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-437	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1, 2-diMe-4-(3, 4-deH-Pip)
1-438	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-Et-2-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-439	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pr-2-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-440	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-Bu-2-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-441	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Phet-2-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-442	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-443	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-444	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1, 2-diEt-4-(3, 4-deH-Pip)
1-445	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-Pr-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-446	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bu-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-447	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-Phet-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-448	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-449	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-450	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Et-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-451	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1, 2-diPr-4-(3, 4-deH-Pip)

4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bu-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip) 1-Phet-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip) 2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-Me-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-Et-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-Pr-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 1, 2-diBu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-Phet-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 2-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip)
4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$	2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-Me-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-Et-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-Pr-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 1, 2-diBu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-Phet-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 2-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip)
4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$	1-Me-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-Et-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-Pr-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 1, 2-diBu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-Phet-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 2-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip)
4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$ $2-NH_2-4-Pym$	1-Et-2-Bu-4-(3,4-deH-Pip) 1-Pr-2-Bu-4-(3,4-deH-Pip) 1,2-diBu-4-(3,4-deH-Pip) 1-Phet-2-Bu-4-(3,4-deH-Pip) 2-Ally1-4-(3,4-deH-Pip)
4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	$\begin{array}{c} 2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym} \\ 2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym} \\ 2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym} \\ 2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym} \\ 2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym} \\ 2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym} \end{array}$	1-Pr-2-Bu-4-(3,4-deH-Pip) 1,2-diBu-4-(3,4-deH-Pip) 1-Phet-2-Bu-4-(3,4-deH-Pip) 2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	$\begin{array}{c} 2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym} \\ 2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym} \\ 2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym} \\ 2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym} \end{array}$	1, 2-diBu-4-(3, 4-deH-Pip) 1-Phet-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip) 2-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip)
4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	$\begin{array}{c} 2-\mathrm{NH_2-4-Pym} \\ 2-\mathrm{NH_2-4-Pym} \\ 2-\mathrm{NH_2-4-Pym} \end{array}$	1-Phet-2-Bu-4-(3,4-deH-Pip) 2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym 2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
4–F–Ph 4–F–Ph	$2-NH_2-4-Pym$	
4-F-Ph	•	4 11 0 411 1 4 40 4 4
		1-Me-2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-Et-2-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip)
4 1 1 H	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pr-2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-Bu-2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-Phet-2-Ally1-4-(3, 4-deH-Pip)
4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Et-2-Bn-4-(3,4-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pr-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bu-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Phet-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Et-2-Phet-4-(3,4-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pr-2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bu-2-Phet-4-(3,4-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1, 2-diPhet-4-(3, 4-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1,2-diMe-4-(4,5-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Et-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pr-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bu-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Phet-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1,2-diEt-4-(4,5-deH-Pip)
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pr-2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
	4-F-Ph	$\begin{array}{llllllllllllllllllllllllllllllllllll$

1-488	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bu-2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
1-489	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Phet-2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
1-490	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-491	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-492	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Et-2-Pr-4-(4, 5-deH-Pip)
1-493	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1, 2-diPr-4-(4, 5-deH-Pip)
1-494	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bu-2-Pr-4-(4, 5-deH-Pip)
1-495	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Phet-2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-496	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Bu-4-(4,5-deH-Pip)
1-497	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-2-Bu-4-(4, 5-deH-Pip)
1-498	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Et-2-Bu-4-(4, 5-deH-Pip)
1-499	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pr-2-Bu-4-(4, 5-deH-Pip)
1-500	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1, 2-diBu-4-(4, 5-deH-Pip)
1-501	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Phet-2-Bu-4-(4,5-deH-Pip)
1-502	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Allyl-4-(4, 5-deH-Pip)
1-503	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-504	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Et-2-Ally1-4-(4,5-deH-Pip)
1-505	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pr-2-Ally1-4-(4,5-deH-Pip)
1-506	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bu-2-Ally1-4-(4,5-deH-Pip)
1-507	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Phet-2-Ally1-4-(4, 5-deH-Pip)
1-508	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Bn-4-(4, 5-deH-Pip)
1-509	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)
1-510	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Et-2-Bn-4-(4, 5-deH-Pip)
1-511	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pr-2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)
1-512	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bu-2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)
1-513	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Phet-2-Bn-4-(4, 5-deH-Pip)
1-514	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-515	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me-2-Phet-4-(4,5-deH-Pip)
1-516	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Et-2-Phet-4-(4,5-deH-Pip)
1-517	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pr-2-Phet-4-(4,5-deH-Pip)
1-518	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Bu-2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-519	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1, 2-diPhet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-520	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	3-(3, 4-deH-Pip)
1-521	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-3-(3,4-deH-Pip)
1-522	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-523	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr-4-(3,4-deH-Pip)
			• *

1-524	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr-4-Pip
1-525	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym.	1-iPr-4-(3,4-deH-Pip)
1-526	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-iPr-4-Pip
1-527	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-528	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-tBu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-529	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-530	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Hx-4-(3,4-deH-Pip)
1-531	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Hp-4-(3, 4-deH-Pip)
1-532	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-0c-4-(3,4-deH-Pip)
1-533	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Nn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-534	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-cPr-4-(3,4-deH-Pip)
1-535	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-cPn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-536	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-cHx-4-(3, 4-deH-Pip)
1-537	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-538	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-539	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-(3-Ph-Pr)-4-(3,4-deH-Pip)
1-540	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-(4-Ph-Bu)-4-(3, 4-deH-Pip)
1-541	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-542	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Propargyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-543	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2, 6, 6, -tetraMe-4-(3, 4-deH-Pip)
1-544	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-(3, 4-deH-Pip)
1-545	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-Pip)
1-546	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind)
1-547	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind)
1-548	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	7-octaH-Ind
1-549	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8-(1, 3, 4, 6, 7, 9a-hexaH-2H-Qui)
1-550	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui)
1-551	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8-octaH-Qui
1-552	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-diMe-4-(3, 4-deH-PiP)
1-553	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1, 2, 2-triMe-4-(3, 4-deH-PiP)
1-554	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-diMe-4-(4, 5-deH-PiP)
1-555	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1, 2, 2-triMe-4-(4, 5-deH-PiP)
1-556	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2,6-diMe-4-(3,4-deH-PiP)
1-557	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1, 2, 6-triMe-4-(3, 4-deH-PiP)
1-558	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-559	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1, 2-diMe-4-(3, 4-deH-Pip)
•			

1-560	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-2-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-561	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr-2-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-562	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bu-2-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-563	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Phet-2-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-564	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-565	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-2-Et-4-(3,4-deH-Pip)
1-566	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1,2-diEt-4-(3,4-deH-Pip)
1-567	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr-2-Et-4-(3,4-deH-Pip)
1-568	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bu-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-569	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Phet-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-570	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-571	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-2-Pr-4-(3,4-deH-Pip)
1-572	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-2-Pr-4-(3,4-deH-Pip)
1-573	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1,2-diPr-4-(3,4-deH-Pip)
1-574	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bu-2-Pr-4-(3,4-deH-Pip)
1-575	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Phet-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-576	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-577	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-2-Bu-4-(3,4-deH-Pip)
1-578	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-579	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-580	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1,2-diBu-4-(3,4-deH-Pip)
1-581	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Phet-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-582	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-583	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-584	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-585	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr-2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-586	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bu-2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-587	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Phet-2-Ally1-4-(3, 4-deH-Pip)
1-588	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-589	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-590	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-591	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-592	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bu-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-593	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Phet-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-594	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-595	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)

1-596	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-2-Phet-4-(3,4-deH-Pip)
1-597	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr-2-Phet-4-(3,4-deH-Pip)
1-598	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bu-2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-599	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1,2-diPhet-4-(3,4-deH-Pip)
1-600	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-601	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1,2-diMe-4-(4,5-deH-Pip)
1-602	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-603	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-604	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bu-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-605	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Phet-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-606	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
1-607	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
1-608	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1,2-diEt-4-(4,5-deH-Pip)
1-609	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr-2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
1-610	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bu-2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
1-611	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Phet-2-Et-4-(4, 5-deH-Pip)
1-612	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-613	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-614	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-615	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1,2-diPr-4-(4,5-deH-Pip)
1-616	4- <b>F-</b> Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bu-2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-617	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Phet-2-Pr-4-(4, 5-deH-Pip)
1-618	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bu-4-(4,5-deH-Pip)
1-619	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-2-Bu-4-(4,5-deH-Pip)
1-620	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-2-Bu-4-(4,5-deH-Pip)
1-621	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr-2-Bu-4-(4,5-deH-Pip)
1-622	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1, 2-diBu-4-(4, 5-deH-Pip)
1-623	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Phet-2-Bu-4-(4, 5-deH-Pip)
1-624	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-625	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-626	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Et-2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-627	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr-2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-628	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Bu-2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-629	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Phet-2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-630	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)
1-631	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me-2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)

1-632	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyn	1-Et-2-Bn-4-(4, 5-deH-Pip)
1-633	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyn	
1-634	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	• •
1-635	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	the contract of the contract o
1-636	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	- (", " " " " " " " " " " " " " " " " " "
1-637	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	
1-638	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	- · · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
1-639	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	•
1-640	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	(1,0 1011 11,1)
1-641	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	
1-642	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	3-(3, 4-deH-Pip)
1-643	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pyr	1-Me-3-(3, 4-deH-Pip)
1-644	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pyr	1-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-645	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-646	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pr-4-Pip
1-647	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-iPr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-648	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-iPr-4-Pip
1-649	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pyr	1-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-650	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-tBu-4-(3,4-deH-Pip)
1-651	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-652	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Hx-4-(3, 4-deH-Pip)
1-653	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Hp-4-(3, 4-deH-Pip)
1-654	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-0c-4-(3, 4-deH-Pip)
1-655	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Nn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-656	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-cPr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-657	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-cPn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-658	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-cHx-4-(3, 4-deH-Pip)
1-659	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-660	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-661	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-(3-Ph-Pr)-4-(3, 4-deH-Pip)
1-662	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-(4-Ph-Bu)-4-(3, 4-deH-Pip)
1-663	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Ally1-4-(3, 4-deH-Pip)
1-664	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Propargy1-4-(3, 4-deH-Pip)
1-665	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2, 2, 6, 6, -tetraMe-4-(3, 4-deH-Pip)
1-666	4-F-Ph		1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-(3, 4-deH-Pip)
1-667	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-Pip)
			-

1-668	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind)
1-669	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind)
1-670	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	7-octaH-Ind
1-671	4-F-Ph.	$2-NH_2-4-Pyr$	8-(1, 3, 4, 6, 7, 9a-hexaH-2H-Qui)
1-672	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pyr	8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui)
1-673	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	8-octaH-Qui
1-674	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2, 2-diMe-4-(3, 4-deH-PiP)
1-675	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1, 2, 2-triMe-4-(3, 4-deH-PiP)
1-676	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2, 2-diMe-4-(4, 5-deH-PiP)
1-677	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1, 2, 2-triMe-4-(4, 5-deH-PiP)
1-678	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2,6-diMe-4-(3,4-deH-PiP)
1-679	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1, 2, 6-triMe-4-(3, 4-deH-PiP)
1-680	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-681	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1, 2-diMe-4-(3, 4-deH-Pip)
1-682	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Et-2-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-683	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pr-2-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-684	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Bu-2-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-685	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Phet-2-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-686	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Et-4-(3,4-deH-Pip)
1-687	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-2-Et-4-(3,4-deH-Pip)
1-688	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1, 2-diEt-4-(3, 4-deH-Pip)
1-689	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pr-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-690	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Bu-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-691	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Phet-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-692	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-693	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-694	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Et-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-695	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1, 2-diPr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-696	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Bu-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-697	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Phet-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-698	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-699	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-700	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Et-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-701	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pr-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-702	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1, 2-diBu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-703	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Phet-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)

1-704	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-705	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-706	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Et-2-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip)
1-707	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pr-2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-708	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Bu-2-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip)
1-709	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Phet-2-Ally1-4-(3, 4-deH-Pip)
1-710	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-711	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-2-Bn-4-(3,4-deH-Pip)
1-712	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Et-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-713	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pr-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-714	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Bu-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-715	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Phet-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-716	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-717	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-718	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Et-2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-719	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pr-2-Phet-4-(3,4-deH-Pip)
1-720	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Bu-2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-721	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1, 2-diPhet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-722	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-723	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1,2-diMe-4-(4,5-deH-Pip)
1-724	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Et-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-725	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pr-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-726	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Bu-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-727	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Phet-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-728	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Et-4-(4, 5-deH-Pip)
1-729	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-2-Et-4-(4, 5-deH-Pip)
1-730	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1, 2-diEt-4-(4, 5-deH-Pip)
1-731	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pr-2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
1-732	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Bu-2-Et-4-(4, 5-deH-Pip)
1-733	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Phet-2-Et-4-(4,5-deH-Pip)
1-734	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Pr-4-(4, 5-deH-Pip)
1-735	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-736	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Et-2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-737	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1, 2-diPr-4-(4, 5-deH-Pip)
1-738	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Bu-2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-739	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Phet-2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)

1-740	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Bu-4-(4,5-deH-Pip)
1-741	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-2-Bu-4-(4,5-deH-Pip)
1-742	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Et-2-Bu-4-(4,5-deH-Pip)
1-743	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pr-2-Bu-4-(4,5-deH-Pip)
1-744	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1,2-diBu-4-(4,5-deH-Pip)
1-745	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Phet-2-Bu-4-(4,5-deH-Pip)
1-746	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-747	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pyr	1-Me-2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-748	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Et-2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-749	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pr-2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-750	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Bu-2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-751	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Phet-2-Ally1-4-(4,5-deH-Pip)
1-752	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)
1-753	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)
1-754	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Et-2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)
1-755	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pr-2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)
1-756	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Bu-2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)
1-757	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Phet-2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)
1-758	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Phet-4-(4,5-deH-Pip)
1-759	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Me-2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-760	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Et-2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-761	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Pr-2-Phet-4-(4,5-deH-Pip)
1-762	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1-Bu-2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-763	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	1, 2-diPhet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-764	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	3-(3,4-deH-Pip)
1-765	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-3-(3, 4-deH-Pip)
1-766	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-767	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pr-4-(3,4-deH-Pip)
1-768	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pr-4-Pip
1-769	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-iPr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-770	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-iPr-4-Pip
1-771	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-772	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-tBu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-773	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-774	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Hx-4-(3, 4-deH-Pip)
1-775	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Hp-4-(3,4-deH-Pip)

1-776	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-0c-4-(3, 4-deH-Pip)
1-777	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Nn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-778	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-cPr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-779	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-cPn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-780	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-cHx-4-(3, 4-deH-Pip)
1-781	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-782	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-783	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-(3-Ph-Pr)-4-(3,4-deH-Pip)
1-784	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-(4-Ph-Bu)-4-(3, 4-deH-Pip)
1-785	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip)
1-786	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Propargyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-787	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2, 2, 6, 6, -tetraMe-4-(3, 4-deH-Pip)
1-788	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-(3, 4-deH-Pip)
1-789	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1, 2, 2, 6, 6, -pentaMe-4-Pip)
1-790	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind)
1-791	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind)
1-792	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	7-octaH-Ind
1-793	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	8-(1, 3, 4, 6, 7, 9a-hexaH-2H-Qui)
1-794	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	8-(1, 3, 4, 6, 9, 9a-hexaH-2H-Qui)
1-795	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	8-octaH-Qui
1-796	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2,2-diMe-4-(3,4-deH-PiP)
1-797	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1, 2, 2-triMe-4-(3, 4-deH-PiP)
1-798	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2, 2-diMe-4-(4, 5-deH-PiP)
1-799	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1, 2, 2-triMe-4-(4, 5-deH-PiP)
1-800	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2,6-diMe-4-(3,4-deH-PiP)
1-801	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1, 2, 6-triMe-4-(3, 4-deH-PiP)
1-802	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-803	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1,2-diMe-4-(3,4-deH-Pip)
1-804	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Et-2-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-805	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pr-2-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-806	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Bu-2-Me-4-(3,4-deH-Pip)
1-807	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Phet-2-Me-4-(3, 4-deH-Pip)
1-808	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-809	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-810	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1, 2-diEt-4-(3, 4-deH-Pip)
1-811	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pr-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)

1-812	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Bu-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-813	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Phet-2-Et-4-(3, 4-deH-Pip)
1-814	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-815	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-816	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Et-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-817	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1, 2-diPr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-818	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Bu-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-819	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Phet-2-Pr-4-(3, 4-deH-Pip)
1-820	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-821	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-822	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Et-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-823	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pr-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-824	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1,2-diBu-4-(3,4-deH-Pip)
1-825	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Phet-2-Bu-4-(3, 4-deH-Pip)
1-826	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Ally1-4-(3,4-deH-Pip)
1-827	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-2-Allyl-4-(3,4-deH-Pip)
1-828	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Et-2-Ally1-4-(3, 4-deH-Pip)
1-829	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pr-2-Ally1-4-(3,4-deH-Pip)
1-830	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Bu-2-Allyl-4-(3, 4-deH-Pip)
1-831	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Phet-2-Ally1-4-(3,4-deH-Pip)
1-832	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-833	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-2-Bn-4-(3,4-deH-Pip)
1-834	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Et-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-835	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pr-2-Bn-4-(3,4-deH-Pip)
1-836	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Bu-2-Bn-4-(3,4-deH-Pip)
1-837	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Phet-2-Bn-4-(3, 4-deH-Pip)
1-838	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-839	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-2-Phet-4-(3,4-deH-Pip)
1-840	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Et-2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-841	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pr-2-Phet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-842	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Bu-2-Phet-4-(3,4-deH-Pip)
1-843	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1, 2-diPhet-4-(3, 4-deH-Pip)
1-844	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-845	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1,2-diMe-4-(4,5-deH-Pip)
1-846	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Et-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-847	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pr-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)

1-848	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Bu-2-Me-4-(4,5-deH-Pip)
1-849	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Phet-2-Me-4-(4, 5-deH-Pip)
1-850	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Et-4-(4, 5-deH-Pip)
1-851	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-2-Et-4-(4, 5-deH-Pip)
1-852	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1, 2-diEt-4-(4, 5-deH-Pip)
1-853	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pr-2-Et-4-(4, 5-deH-Pip)
1-854	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Bu-2-Ei-4-(4, 5-deH-Pip)
1-855	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Phet-2-Et-4-(4, 5-deH-Pip)
1-856	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Pr-4-(4, 5-deH-Pip)
1-857	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-2-Pr-4-(4,5-deH-Pip)
1-858	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Et-2-Pr-4-(4, 5-deH-Pip)
1-859	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1, 2-diPr-4-(4, 5-deH-Pip)
1-860	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Bu-2-Pr-4-(4, 5-deH-Pip)
1-861	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Phet-2-Pr-4-(4, 5-deH-Pip)
1-862	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Bu-4-(4, 5-deH-Pip)
1-863	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-2-Bu-4-(4, 5-deH-Pip)
1-864	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Et-2-Bu-4-(4, 5-deH-Pip)
1-865	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pr-2-Bu-4-(4, 5-deH-Pip)
1-866	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1,2-diBu-4-(4,5-deH-Pip)
1-867	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Phet-2-Bu-4-(4, 5-deH-Pip)
1-868	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-869	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-2-Allyl-4-(4,5-deH-Pip)
1-870	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Et-2-Allyl-4-(4, 5-deH-Pip)
1-871	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pr-2-Allyl-4-(4, 5-deH-Pip)
1-872	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Bu-2-Allyl-4-(4, 5-deH-Pip)
1-873	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Phet-2-Ally1-4-(4, 5-deH-Pip)
1-874	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Bn-4-(4, 5-deH-Pip)
1-875	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)
1-876	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Et-2-Bn-4-(4, 5-deH-Pip)
1-877	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pr-2-Bn-4-(4,5-deH-Pip)
1-878	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Bu-2-Bn-4-(4, 5-deH-Pip)
1-879	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Phet-2-Bn-4-(4, 5-deH-Pip)
1-880	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-881	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Me-2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-882	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Et-2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-883	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Pr-2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)

1-884	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1-Bu-2-Phet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-885	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	1, 2-diPhet-4-(4, 5-deH-Pip)
1-886	Ph	4-Pyr	7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind)
1-887	Ph	4-Pyr	7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind)
1-888	3-F-Ph	4-Pyr	7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind)
1-889	3-F-Ph	4-Pyr	7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind)
1-890	3-C1-Ph	4-Pyr	7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind)
1-891	3-C1-Ph	4-Pyr	7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind)
1-892	3,4-diF-Ph	4-Pyr	7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind)
1-893	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind)
1-894	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	7-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-hexaH-Ind)
1-895	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	7-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-hexaH-Ind)

化合物 番 号	R <sup>t</sup>	R²	R <sup>5</sup>
2-1	Ph	4-Pyr	1-Me
2-2	Ph	4-Pyr	1-E t
2-3	Ph	4-Pyr	1- <b>P</b> r
2-4	Ph	4-Pyr	1,1-diMe
2-5	Ph	4-Pyr	2-Me
2-6	Ph	4-Pyr	2–E t
2-7	Ph	4-Pyr	2-Pr
2-8	Ph	4-Pyr	2-Bu
2-9	Ph	4-Pyr	2-A11y1
2-10	Ph	4-Pyr	2-Ph
2-11	Ph	4-Pyr	2-Bn

2-12	Ph	4-Pyr	2-Phe t
2-13	Ph	4-Pyr	2, 2-diMe
2-14	Ph	4-Pyr	2-ОН
2-15	Ph	4-Pyr	2-Me0
2-16	Ph	4-Pyr .	2-Et0
2-17	Ph	4-Pyr	2-PrO
2-18	Ph	4-Pyr	2, 2-di (MeO)
2-19	Ph	4-Pyr	2, 2-di (EtO)
2-20	Ph	4-Pyr	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
2-21	Ph	4-Pyr	2-0xo
2-22	Ph	4-Pyr	2-F
2-23	Ph	4-Pyr	2-C1
2-24	Ph	4-Pyr	2-Br
2-25	Ph	4-Pyr	2-I
2-26	Ph	4-Pyr	2, 2-diF
2-27	Ph	4-Pyr	2, 2-diC1
2-28	Ph	4-Pyr	2, 2-diBr
2-29	Ph	4-Pyr	. 3-Me
2-30	Ph	4-Pyr	3-E t
2-31	Ph	4-Pyr	3-Pr
2-32	Ph	4-Pyr	3,3-diMe
2-33	Ph	4-Pyr	5-Me
2-34	Ph	4-Pyr	5-E t
2-35	Ph	4-Pyr	5-Pr
2-36	Ph	4-Pyr	5,5-diMe
2-37	Ph	4-Pyr	6-Me
2-38	Ph	4-Pyr	6-E t
2-39	Ph	4-Pyr	6-Pr
2-40	Ph	4-Pyr	6,6-diMe
2-41	Ph	4-Pyr	6-0x0
2-42	Ph	4-Pyr	8-Me
2-43	Ph	4-Pyr	8-E t
2-44	Ph	4-Pyr	8-Pr
2-45	Ph	4-Pyr	8-Ph
2-46	Ph	4-Pyr	8a-Me
2-47	Ph	4-Pyr	8a-Et

2-48	Ph	4-Pyr	8a-Pr
2-49	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me
2-50	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-E t
2-51	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pr
2-52	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1,1-diMe
2-53	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Me
2-54	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-E t
2-55	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Pr
2-56	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Bu
2-57	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Allyl
2-58	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Ph
2-59	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Bn
2-60	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Phet
2-61	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2,2-diMe
2-62	Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2-0H
2-63	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-MeO
2-64	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-E t O
2-65	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Pr0
2-66	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-di (MeO)
2-67	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-di (Et0)
2-68	Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
2-69	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-0xo
2-70	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-F
2-71	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-C1
2-72	Ph	$. \hspace{1.5cm} 2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym}$	2-Br
2-73	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-I
2-74	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-d i F
2-75	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-diCl
2-76	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-diBr
2-77	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Me
2-78	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-E t
2-79	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Pr
2-80	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3,3-diMe
2-81	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-Me
2-82	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-E t
2-83	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-Pr

2-84	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5,5-diMe
2-85	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-Me
2-86	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-E t
2-87	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-Pr
2-88	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6,6-diMe
2-89	Ph	$2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym}$	6-0xo
2-90	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Me
2-91	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-E t
2-92	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Pr
2-93	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Ph
2-94	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Me
2-95	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Et
2-96	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Pr
2-97	Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me
2-98	Ph	2-MeNH-4-Pym	1-E t
2-99	Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr
2-100	Ph	2-MeNH-4-Pym	1,1-diMe
2-101	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Me
2-102	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-E t
2-103	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Pr
2-104	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bu
2-105	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Allyl
2-106	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Ph
2-107	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bn
2-108	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Phet
2-109	Ph	2-MeNH-4-Pym	2,2-diMe
2-110	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-0H
2-111	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Me0
2-112	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-E t 0
2-113	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Pr0
2-114	Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-di (MeO)
2-115	Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-di (EtO)
2-116	Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
2-117	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-0xo
2-118	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-F
2-119	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-C1

2-120	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Br
2-121	Ph	2-MeNH-4-Pym	2-I
2-122	Ph	2-MeNH-4-Pym	2,2-diF
2-123	Ph	2-MeNH-4-Pym	2,2-diCl
2-124	Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-diBr
2-125	Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Me .
2-126	Ph	2-MeNH-4-Pym	3-E t
2-127	Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Pr
2-128	Ph	2-MeNH-4-Pym	3,3-diMe
2-129	Ph	2-MeNH-4-Pym	5-Me
2-130	Ph	2-MeNH-4-Pym	5-E t
2-131	Ph	2-MeNH-4-Pym	5-P r
2-132	Ph	2-MeNH-4-Pym	5,5-diMe
2-133	Ph	2-MeNH-4-Pym	6-Me
2-134	Ph	2-MeNH-4-Pym	6-E t
2-135	Ph	2-MeNH-4-Pym	6-Pr
2-136	Ph	2-MeNH-4-Pym	6,6-diMe
2-137	Ph	2-MeNH-4-Pym	6-0x0
2-138	Ph	2-MeNH-4-Pym	8-Me
2-139	Ph	2-MeNH-4-Pym	8-E t
2-140	Ph	2-MeNH-4-Pym	8-Pr
2-141	Ph	2-MeNH-4-Pym	8-Ph
2-142	Ph	2-MeNH-4-Pym	8a-Me
2-143	Ph	2-MeNH-4-Pym	8a-Et
2-144	Ph	2-MeNH-4-Pym	8a-Pr
2-145	3-F-Ph	4-Pyr	1-Me
2-146	3-F-Ph	4-Pyr	1-E t
2-147	3-F-Ph	4-Pyr	1-Pr
2-148	3-F-Ph	4−P·yr	1,1-diMe
2-149	3-F-Ph	4-Pyr	2-Me
2-150	3-F-Ph	4-Pyr	2-E t
2-151	3-F-Ph	4-Pyr	2-Pr
2-152	3-F-Ph	4-Pyr	2-Bu ·
2-153	3-F-Ph	4-Pyr	2-A11y1
2-154	3-F-Ph	4-Pyr	2-Ph
2-155	3-F-Ph	4-Pyr	2-Bn
6			

2-156	3-F-Ph	4-Pyr	2-Phe t
2-157	3-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diMe
2-158	3-F-Ph	4-Pyr	2-OH
2-159	3-F-Ph	4-Pyr	2-Me0
2-160	3-F-Ph	4-Pyr	2-Et0
2-161	3-F-Ph	4-Pyr	2-Pr0
2-162	3-F-Ph	4-Pyr	2, 2-di (MeO)
2-163	3-F-Ph	4-Pyr	2, 2-di (Et0)
2-164	3-F-Ph	4-Pyr	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C
2-165	3-F-Ph	4-Pyr	2-0xo
2-166	3-F-Ph	4-Pyr	2-F
2-167	3-F-Ph	4-Pyr	2-C1
2-168	3-F-Ph	4-Pyr	2-Br
2-169	3-F-Ph	4-Pyr	2-I
2-170	3-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diF
2-171	3-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diCl
2-172	3-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diBr
2-173	3-F-Ph	4-Pyr	3-Me
2-174	3-F-Ph	4-Pyr	3-E t
2-175	3-F-Ph	4-Pyr	3-Pr
2-176	3-F-Ph	4-Pyr	3,3-diMe
2-177	3-F-Ph	. 4-Pyr	5-Me
2-178	3-F-Ph	4-Pyr	5-E t
2-179	3-F-Ph	4-Pyr	5-Pr
2-180	3-F-Ph	4-Pyr	5,5-diMe
2-181	3-F-Ph	4-Pyr	6-Me
2-182	3-F-Ph	4-Pyr	6-Et
2-183	3-F-Ph	4-Pyr	6-Pr
2-184	3-F-Ph	4-Pyr	6,6-diMe
2-185	3-F-Ph	4-Pyr	6-0xo
2-186	3-F-Ph	4-Pyr	8-Me
2-187	3-F-Ph	4-Pyr	8-Et
2-188	3-F-Ph	4-Pyr	8-Pr
2-189	3-F-Ph	4-Pyr	8-Ph
2-190	3-F-Ph	4-Pyr	8a-Me
2-191	3-F-Ph	4-Pyr	8a-Et

2-192	3-F-Ph	4-Pyr	8a-Pr
2-193	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me
2-194	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-E t
2-195	3FPh	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-Pr
2-196	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1,1-diMe
2-197	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2-Me
2-198	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-E t
2-199	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Pr
2-200	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Bu
2-201	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Allyl
2-202	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Ph
2-203	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Bn
2-204	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Phet
2-205	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-diMe
2-206	3F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-0H
2-207	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-MeO
2-208	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-E t O
2-209	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Pr0
2-210	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-di (MeO)
2-211	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-di (Et0)
2-212	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0
2-213	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-0xo
2-214	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-F
2-215	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-C1
2-216	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Br
2-217	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-I
2-218	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-diF
2-219	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-diCl
2-220	· 3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-diBr
2-221	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Me
2-222	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-E t
2-223	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Pr
2-224	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3,3-diMe
2-225	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-Me
2-226	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5–E t
2-227	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-Pr

2-228	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5,5-diMe
2-229	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$ 6-Me	
2-230	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$ 6-Et	
2-231	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-Pr
2-232	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6,6-diMe
2-233	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-0xo
2-234	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	8-Me
2-235	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	8-E t
2-236	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Pr
2-237	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Ph
2-238	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	8a-Me
2-239	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Et
2-240	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Pr
2-241	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym.	1-Me
2-242	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-E t
2-243	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr
2-244	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1,1-diMe
2-245	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Me
2-246	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-E t
2-247	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Pr
2-248	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bu
2-249	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Ally1
2-250	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Ph
2-251	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bn
2-252	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Phet
2-253	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2,2-diMe
2-254	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-0H
2-255	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Me0
2-256	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-EtO
2-257	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Pr0
2-258	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-di (MeO)
2-259	·3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-di (Et0)
2-260	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
2-261	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-0xo
2-262	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-F
2-263	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-C1

2-264	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Br
2-265	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-I
2-266	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-diF
2-267	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-diCl
2-268	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-diBr
2-269	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Me
2-270	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	3-E t
2-271	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	. 3-Pr
2-272	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	3,3-diMe
2-273	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	5-Me
2-274	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	5-E t
2-275	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	5-Pr-
2-276	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	5,5-diMe
2-277	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	6-Me
2-278	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	6-E t
2-279	3- <b>F-</b> Ph	2-MeNH-4-Pym	6-Pr
2-280	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	6,6-diMe
2-281	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	6-0xo
2-282	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8-Me
2-283	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8-Et
2-284	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8-Pr :
2-285	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8-Ph
2-286	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8a-Me
2-287	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8a-Et
2-288	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8a-Pr
2-289	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me
2-290	4-F-Ph	4-Pyr	1 –E t
2-291	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr
2-292	4-F-Ph	4-Pyr	1,1-diMe
2-293	4-F-Ph	4-Pyr	2-Me
2-294	4-F-Ph	4-Pyr	2-E t
2-295	4-F-Ph	4-Pyr	2-Pr
2-296	4-F-Ph	4-Pyr	2-Bu
2-297	4-F-Ph	4-Pyr	2-Ally1
2-298	4-F-Ph	4-Pyr	2-Ph
2-299	4-F-Ph	4-Pyr	2-Bn

2-300	4-F-Ph	4-Pyr	2-Phe t
2-301	4-F-Ph	4-Pyr	2,2-diMe
2-302	4-F-Ph	4-Pyr	2-ОН
2-303	4-F-Ph	4-Pyr	2-Me0
2-304	4-F-Ph	4-Pyr	2-Et0
2-305	4-F-Ph	4-Pyr	2-Pr0
2-306	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-di (MeO)
2-307	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-di (EtO)
2-308	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
2-309	4-F-Ph	4-Pyr	2-0xo
2-310	4-F-Ph	4-Pyr	2-F
2-311	4-F-Ph	4-Pyr	2-C1
2-312	4-F-Ph	4-Pyr	2-Br
2-313	4-F-Ph	4-Pyr	2-I
2-314	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diF
2-315	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diCl
2-316	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diBr
2-317	4-F-Ph	4-Pyr	3-Me
2-318	4-F-Ph	4-Pyr	3-E t
2-319	4-F-Ph	4-Pyr	3-Pr
2-320	4-F-Ph	4-Pyr	3, 3-diMe
2-321	4-F-Ph	4-Pyr	5-Me
2-322	4-F-Ph	4-Pyr	5-Et
2-323	4-F-Ph	4-Pyr	5-Pr
2-324	4-F-Ph	4-Pyr	5,5-diMe
2-325	4-F-Ph	4-Pyr	6-Ме
2-326	4-F-Ph	4-Pyr	6-E t
2-327	4-F-Ph	4-Pyr	6-Pr
2-328	4-F-Ph	4-Pyr	6,6-diMe
2-329	4-F-Ph	4-Pyr .	6-0xo
2-330	4-F-Ph	4-Pyr	8-Me
2-331	4-F-Ph	4-Pyr	8-E t
2-332	4-F-Ph	4-Pyr	8-Pr
2-333	4-F-Ph	4-Pyr	8-Ph
2-334	4-F-Ph	4-Pyr	8a-Me
2-335	4-F-Ph	4-Pyr	8a-Et

2-336	4-F-Ph	4-Pyr	8a-Pr .
2-337	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me
2-338	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Et
2-339	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Pr
2-340	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1,1-diMe
2-341	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2-Me
2-342	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2-E t
2-343	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Pr
2-344	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Bu
2-345	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Allyl
2-346	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Ph
2-347	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Bn
2-348	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2–Phe t
2-349	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2,2-diMe
2-350	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-0H
2-351	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-MeO
2-352	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-EtO
2-353	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Pr0
2-354	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2,2-di(MeO)
2-355	4- <b>F-</b> Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-di (EtO)
2-356	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O
2-357	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-0xo
2-358	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-F
2-359	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-01
2-360	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Br
2-361	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-I
2-362	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-diF
2-363	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-diCl
2-364	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2,2-diBr
2-365	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Me
2-366	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-E t
2-367	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Pr
2-368	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3,3-diMe
2-369	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-Me
2-370	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-E t
2-371	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-Pr

2-372	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5,5-diMe
2-373	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-Me
2-374	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-E t
2-375	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-Pr
2-376	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6,6-diMe
2-377	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-0xo
2-378	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Me
2-379	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-E t
2-380	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Pr
2-381	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Ph
2-382	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Me
2-383	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Et
2-384	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Pr
2-385	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me
2-386	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-E t
2-387	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr
2-388	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	1,1-diMe
2-389	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Me
2-390	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2–E t
2-391	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Pr
2-392	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bu
2-393	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-A11y1
2-394	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Ph
2-395	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bn
2-396	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Phe t
2-397	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2,2-diMe
	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-ОН
2-399	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Me0
2-400	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Et0
2-401	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-PrO
2-402	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-di (MeO)
2-403	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-di (EtO)
2-404	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
2-405	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-0xo
2-406	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-F
2-407	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-C1

2-408	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Br
2-409	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-I
2-410	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-diF
2-411	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-diCl
2-412	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-diBr
2-413	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Me
2-414	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	3-E t
2-415	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Pr
2-416	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	3,3-diMe
2-417	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	5-Me
2-418	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	5-E t
2-419	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	5-Pr
2-420	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	5,5-diMe
2-421	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	6-Me
2-422	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	6-E t
2-423	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	6-Pr
2-424	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	6,6-diMe
2-425	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	6-0xo
2-426	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8-Me
2-427	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8-E t
2-428	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	· 8-Pr
2-429	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8-Ph
2-430	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8a-Me
2-431	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8a-Et
2-432	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	8a-Pr
2-433	3-C1-Ph	4-Pyr	1-Me
2-434	3-C1-Ph	4-Pyr	1-E t
2-435	3-C1-Ph	4-Pyr	1-Pr
2-436	3-C1-Ph	4-Pyr	1,1-diMe
2-437	3-C1-Ph	4-Pyr	2-Me
2-438	3-C1-Ph	4-Pyr	2–E t
2-439	3-C1-Ph	4-Pyr	2- <b>P</b> r
2-440	3-C1-Ph	4-Pyr	2-Bu
2-441	3-C1-Ph	4-Pyr	2-Allyl
2-442	3-C1-Ph	4-Pyr	2-Ph
2-443	3-C1-Ph	4-Pyr	2-Bn

2-444	3-C1-Ph	4-Pyr	2-Phe t
2-445	3-C1-Ph	4-Pyr	2,2-diMe
2-446	3-C1-Ph	4-Pyr	2-ОН
2-447	3-C1-Ph	4-Pyr	2-MeO
2-448	3-C1-Ph	4-Pyr	2-EtO
2-449	3-C1-Ph	4-Pyr	2-Pr0
2-450	3-C1-Ph	4-Pyr	2, 2-di (MeO)
2-451	3-C1-Ph	4-Pyr	2, 2-di (Et0)
2-452	3-C1-Ph	4-Pyr	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
2-453	3-C1-Ph	4-Pyr	2-0xo
2-454	3-C1-Ph	4-Pyr	2-F
2-455	3-C1-Ph	4-Pyr	2-C1
2-456	3-C1-Ph	4-Pyr	2-Br
2-457	3-C1-Ph	4-Pyr	2-I
2-458	3-C1-Ph	4-Pyr	2, 2-diF
2-459	3-C1-Ph	4-Pyr	2, 2-diC1
2-460	3-C1-Ph	4-Pyr	2,2-diBr
2-461	3-C1-Ph	4-Pyr	3-Me
2-462	3-C1-Ph	4-Pyr	3-E t
2-463	3-C1-Ph	4-Pyr	3-Pr
2-464	3-C1-Ph	4-Pyr	3,3-diMe
2-465	3-C1-Ph	4-Pyr	5-Me
2-466	3-C1-Ph	4-Pyr	5-E t
2-467	3-C1-Ph	4-Pyr	5-Pr
2-468	3-C1-Ph	4-Pyr	5,5-diMe
2-469	3-C1-Ph	4-Pyr	6-Ме
2-470	3-Cl-Ph	4-Pyr	6-E t
2-471	3-Cl-Ph	4-Pyr	6-Pr
2-472	3-C1-Ph	4-Pyr	6,6-diMe
2-473	3-C1-Ph	4-Pyr	6-0xo
2-474	3-C1-Ph	4-Pyr	8-Me
2-475	3-C1-Ph	4-Pyr	8-E t
2-476	3-C1-Ph	4-Pyr	8-Pr
2-477	3-C1-Ph	4-Pyr	8-Ph
2-478	3-C1-Ph	4-Pyr	8a-Me
2-479	3-CI-Ph	4-Pyr	8a-Et

2-480	3-C1-Ph	4-Pyr	8a-Pr
2-481	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me
2-482	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-E t
2-483	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	. 1-Pr
2-484	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	. 1,1-diMe
2-485	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Me
2-486	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-E t
2-487	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Pr
2-488	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Bu
2-489	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Ally1
2-490	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Ph
2-491	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Bn
2-492	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Phet
2-493	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2,2-diMe
2-494	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-ОН .
2-495	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-MeO
2-496	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-E t O
2-497	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Pr0
2-498	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-di (MeO)
2-499	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-di (Et0)
2-500	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O
2-501	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-0x0
2-502	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-F
2-503	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-C1
2-504	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Br
2-505	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-I
2-506	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-diF
2-507	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2,2-diCl
2-508	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-diBr
2-509	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Me
2-510	3-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	3-E t
2-511	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Pr
2-512	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3,3-diMe
2-513	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-Me
2-514	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-E t
2-515	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-Pr

2-516	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5,5-diMe
2-517	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-Me
2-518	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-E t
2-519	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-Pr
2-520	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6,6-diMe
2-521	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-0xo
2-522	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Me
2-523	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-E t
2-524	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Pr
2-525	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Ph
2-526	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Me
2-527	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Et
2-528	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Pr
2-529	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me
2-530	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-E t
2-531	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr
2-532	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	1,1-diMe
2-533	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Me
2-534	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-E t
2-535	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Pr
2-536	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bu
2-537	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Allyl
2-538	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Ph
2-539	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bn
2-540	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Phet
2-541	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-diMe
2-542	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-ОН
2-543	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Me0
2-544	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-E t O
2-545	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Pr0
2-546	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-di (MeO)
2-547	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-di (Et0)
2-548	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
2-549	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-0x0
2-550	3-Cl-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-F
2-551	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-C1
•			

2-552	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Br
2-553	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	· 2-I
2-554	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-diF
2-555	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-diCl
2-556	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-diBr
2-557	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Me
2-558	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Et
2-559	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Pr
2-560	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	3,3-diMe
2-561	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	5-Me
2-562	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	5-E t
2-563	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	5-Pr
2-564	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	5,5-diMe
2-565	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	6-Me
2-566	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	6-E t
2-567	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	6-Pr
<b>2-568</b>	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	6,6-diMe
2-569	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	6-0x0
2-570	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	8-Me
2-571	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	8-E t
2-572	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	· 8-Pr
2-573	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	8-Ph
2-574	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	8a-Me
2-575	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	8a-Et
2-576	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym.	8a-Pr
2-577	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	1-Me
2-578	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	1-E t
2-579	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	1-Pr
2-580	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	1,1-diMe
2-581	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Me
2-582	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-E t
2-583	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Pr
2-584	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Bu
2-585	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Ally1
2-586	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Ph
2-587	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Bn
			•

2-588	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Phet
2-589	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	2,2-diMe
2-590	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-ОН
2-591	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Me0
2-592	3-CF <sub>3</sub> -Ph	·4-Pyr	2-E t 0
2-593	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Pr0
2-594	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2, 2-di (MeO)
2-595	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2, 2-di (EtO)
2-596	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
2-597	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-0xo
2-598	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-F
2-599	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-C1
2-600	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Br
2-601	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	2-I
2-602	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	2, 2-diF
2-603	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2, 2-diCl
2-604	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2, 2-diBr
2-605	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	3-Ме
2-606	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	3-Et
2-607	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	3-Pr
2-608	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	3, 3-diMe
2-609	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	5-Me
2-610	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	5–E t
2-611	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	5-Pr
2-612	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	5,5-diMe
2-613	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	6-Me
2-614	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	6–E t
2-615	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	. 6-Pr
2-616	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	6,6-diMe
2-617	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	6-0x0
2-618	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	8-Me
2-619	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	8-E t
2-620	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	8-Pr
2-621	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	8-Ph
2-622	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	8a-Me
2-623	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	8a-Et

2-624	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	8a-Pr
2-625	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me
2-626	$3-CF_3-Ph$	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-E t
2-627	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-Pr
2-628	$3-CF_3-Ph$	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1,1-diMe
2-629	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Me
2-630	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-E t
2-631	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Pr
2-632	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Bu
2-633	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Allyl
2-634	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Ph
2-635	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Bn
2-636	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	2-Phet
2-637	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-diMe
2-638	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	2-ОН
2-639	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	2-MeO
2-640	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2-E t O
2-641	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Pr0
2-642	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2,2-di(MeO)
2-643	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-di (Et0)
2-644	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C
2-645	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-0xo
2-646	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-F
2-647	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-C1
2-648	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Br
2-649	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-I
2-650	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-diF
2-651	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-diCl
2-652	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-diBr
2-653	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Me
2-654	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-E t
2-655	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	3-Pr
2-656	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3,3-diMe
2-657	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-Me
2-658	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-E t
2-659	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-Pr

2-660	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5,5-diMe
2-661	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	6-Ме
2-662	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	6-E t
2-663	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	6-Pr
2-664	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6,6-diMe
2-665	$3-CF_3-Ph$	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	6-0xo
2-666	$3-CF_3-Ph$	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	8-Me
2-667	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	8-E t
.2-668	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Pr
2-669	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Ph
2-670	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Me
2-671	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Et
2-672	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Pr
2-673	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me
2-674	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	1-E t
2-675	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr
2-676	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	1,1-diMe
2-677	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Me
2-678	$3-CF_3-Ph$	2-MeNH-4-Pym	2-E t
2-679	$3-CF_3-Ph$	2-MeNH-4-Pym	2-Pr
2-680	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bu
2-681	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Allyl
2-682	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Ph
2-683	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bn
2-684	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Phet
2-685	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2,2-diMe
2-686	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2-0H
2-687	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2-MeO
2-688	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2-E t O
2-689	$3-CF_3-Ph$	2-MeNH-4-Pym	2-Pr0
2-690	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-di (Me0)
2-691	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-di (Et0)
2-692	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
2-693	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2-0x0
2-694	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2-F
2-695	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2-C1

2-696	3-CF <sub>3</sub> -Ph	, 2-MeNH-4-Pym	2-Br .
2-697	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2-I
2-698	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2,2-diF
2-699	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-diCl
2-700	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-d i Br
2-701	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Me
2-702	$3-CF_3-Ph$	2-MeNH-4-Pym	3–E t
2-703	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	3-Pr
2-704	$3-CF_3-Ph$	2-MeNH-4-Pym	3,3-diMe
2-705	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	5-Me
2-706	$3-CF_3-Ph$	2-MeNH-4-Pym	5-E t
2-707	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	5-Pr
2-708	· 3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	5,5-diMe
2-709	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	6-Me
2-710	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	6-E t
2-711	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	6-Pr
2-712	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	6,6-diMe
2-713	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	6-0xo
2-714	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	8-Me
2-715	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	8-Et
2-716	$3-CF_3-Ph$	2-MeNH-4-Pym	8-Pr:::::
2-717	$3-CF_3-Ph$	2-MeNH-4-Pym	8-Ph
2-718	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	8a-Me
2-719	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	8a-Et
2-720	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	8a-Pr
2-721	3,4-diF-Ph	4-Pyr	1-Me
2-722	3,4-diF-Ph	4-Pyr	1-E t
2-723	3,4-diF-Ph	4-Pyr	1-Pr
2-724	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	1,1-diMe
2-725	3,4-diF-Ph	4-Pyr	· 2-Me
2-726	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2-E t
2-727	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	2-Pr
2-728	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2-Bu
2-729	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2-Ally1
2-730	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2-Ph
2-731	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2-Bn

2-732	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	2-Phet
2-733	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	2, 2-d i Me
2-734	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	2-0H
2-735	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2-MeO
2-736	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	2-EtO
2-737	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2-Pr0 ·
2-738	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2, 2-di (MeO)
2-739	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2, 2-di (Et0)
2-740	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0
2-741	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2-0xo
2-742	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	2-F
2-743	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2-C1
2-744	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	2-Br
2-745	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	· 2-I
2-746	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	2,2-diF
2-747	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2, 2-diCl
2-748	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2, 2-diBr
2-749	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	3-Ме
2-750	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	3-Et
2-751	3,4-diF-Ph	4-Pyr	3-Pr
2-752	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	3,3-diMe
2-753	3,4-diF-Ph	4-Pyr	5-Me
2-754	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	5–E t
2-755	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	5- <b>P</b> r
2-756	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	5,5-diMe
2-757	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	6- <b>M</b> e
2-758	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	6–E t
2-759	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	6-Pr
2-760	3,4-diF-Ph	4-Pyr	6,6-diMe
2-761	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	6-0xo
2-762	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	8-Me
2-763	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	8–E t
2-764	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	8-Pr
2-765	3, 4-diF-Ph	4-Pyr'	8-Ph
2-766	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	8a-Me
2-767	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	8a-Et

2-768	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	8a-Pr
2-769	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	1-Me
2-770	3, 4-d i F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1-E t
2-771	3, 4-d i F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1- <b>P</b> r
2-772	3, 4-d i F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	1,1-diMe
2-773	3,4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2-Me
2-774	3,4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2–E t
2-775	3,4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2-Pr
2-776	3,4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	2-Bu
2-777	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-A11y1
2-778	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Ph
2-779	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Bn
2-780	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Phet
2-781	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2,2-diMe
2-782	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-0H
2-783	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Me0
2-784	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-EtO
2-785	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-PrO
2-786	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-di (MeO)
2-787	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-di (EtO)
2-788.	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
2-789	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-0xo
2-790	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-F
2-791	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-61
2-792	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-Br
2-793	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2-I
2-794	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2,2-diF
2-795	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2,2-diCl
2-796	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	2,2-diBr
2-797	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Ме
2-798	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-E t
2-799	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3-Pr
2-800	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	3,3-diMe
2-801	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-Me
2-802	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-Et
2-803	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5-Pr

2-804	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	5,5-diMe
2-805	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	· 6-Me
2-806	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-E t
2-807	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-Pr
2-808	3, 4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	6,6-diMe
2-809	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6-0x0
2-810	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Me
2-811	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-E t
2-812	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Pr
2-813	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8-Ph
2-814	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Me
2-815	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Et
2-816	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	8a-Pr
2-817	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Me
2-818	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-E t
2-819 .	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	1-Pr
2-820	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	1,1-diMe
2-821	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Me
2-822	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-E t
2-823	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Pr
2-824	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bu
2-825	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-A11y1
2-826	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Ph
2-827	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Bn
2-828	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Phet
2-829	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2,2-diMe
2-830	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-OH
2-831	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Me0
2-832	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Et0
2-833	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-Pr0
2-834	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-di (MeO)
2-835	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-di (EtO)
2-836	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
2-837	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-0xo
2-838	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-F
2-839	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	2-C1

2-840	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		2-Br
2-841	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		2-I
2-842	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		2, 2-diF
2-843	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		2,2-diCl
2-844	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		2, 2-diBr
2-845	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		3-Me
2-846	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		3∸E t
2-847	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		3-Pr
2-848	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	,	3,3-diMe
2-849	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		5-Me
2-850	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		5-E t
2-851	3,4-diF-Ph	. 2-MeNH-4-Pym		5-Pr
2-852	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		5,5-diMe
2-853	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		6-Me
2-854	3, 4-d i F-Ph	2-MeNH-4-Pym		6-E t
2-855	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		6-Pr
2-856	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		6,6-diMe
2-857	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		6-0xo
2-858	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		8-Me
2-859	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		8-E t
2-860	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	•	8-Pr·
2-861	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		8-Ph
2-862	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		8a-Me
2-863	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		8a-Et
2-864	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym		8a-Pr
2-865	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr		2-0H
2-866	4-F-Ph	2-Me0-4-Pyr		2-Me0
2-867	4-F-Ph	2-Me0-4-Pyr		2-Ph
2-868	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr		8-Me
2-869	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr		2-F
2-870	4-F-Ph	2-Me0-4-Pyr	•	2-C1
2-871	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr		2-Br
2-872	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr		2, 2-diF
2-873	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr		2, 2-diCl
2-874	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$		2-0H
2-875	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$		2-Me0

2-876	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Ph
2-877	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	8-Me
2-878	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-F
2-879	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-C1
2-880	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2-Br
2-881	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2, 2-diF
2-882	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	2,2-diCl
2-883	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-0H
2-884	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-MeO
2-885	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Ph
2-886	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	8-Me
2-887	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-F
2-888	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-C1
2-889	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2-Br
2-890	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2,2-diF
2-891	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	2,2-diCl
2-892	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	2-0H
2-893	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	2-Me0
2-894	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	2-Ph
2-895	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	8-Me
2-896	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pyr	2-F
2-897	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	2-C1
2-898	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	2-Br
2-899	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	2,2-diF
2-900	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	2,2-diCl
2-901	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	2-0H
2-902	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	2-Me0
2-903	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	2-Ph
2-904	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	8-Me
2-905	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	2-F
2-906	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	2-C1
2-907	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	2-Br
2-908	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	2, 2-diF
2-909	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	2,2-diCl
2-910	4-F-Ph	4-Pym	2-0H
2-911	4-F-Ph	4-Pym	. 2-MeO

.

1.

2-912	4-F-Ph	4-Pym	2-Ph
2-913	4-F-Ph	4-Pym	8-Me
2-914	4-F-Ph	4-Pym	2-F
2-915	4-F-Ph	4-Pym	2-C1
2-916	4-F-Ph	4-Pym	2-Br
2-917	4-F-Ph	4-Pym	2, 2-diF
2-918	4-F-Ph	4-Pym	- 2, 2-diCl
2-919	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	2-0H
2-920	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	2-MeO
2-921	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	2-Ph
2-922	4-F-Ph	2-Me0-4-Pym	8-Me
2-923	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	2-F
2-924	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	2-C1
2-925	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	2-Br
2-926	4-F-Ph	2-Me0-4-Pym	2, 2-diF
2-927	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	2,2-diCl
2-928	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	2-0H
2-929	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	2-Me0
2-930	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	2-Ph
2-931	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	8-Me
2-932	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4$ -Pym	2-F
2-933	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	2-C1
2-934	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	2-Br
2-935	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	2, 2-diF
2-936	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	2, 2-diCl
2-937	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	2-0H
2-938	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	2-Me0
2-939	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	2-Ph
2-940	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	8-Me
2-941	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	2-F
2-942	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	2-C1
2-943	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	2-Br
2-944	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	2, 2-d i F
2-945	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	2,2-diCl
2-946	Ph	4-Pyr	$6, 6-(CH_2)_2-$
2-947	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	$6, 6-(CH_2)_2-$

2-948	Ph	2-MeNH-4-Pym	6,6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-949	3-F-Ph	4-Pyr	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-950	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-951	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-952	4-F-Ph	4-Pyr	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-953	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-954	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-955	3-C1-Ph	4-Pyr	$6, 6-(CH_2)_2$
2-956	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-957	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-958	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-959	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-960	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	$6, 6-(CH_2)_2-$
2-961	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-962	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-963	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-964	Ph	4-Pyr	6,6-diF
2-965	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6,6-diF
2-966	Ph	2-MeNH-4-Pym	6,6-diF
2-967	3-F-Ph	4-Pyr	6,6-diF
2-968	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6,6-diF
2-969	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	6,6-diF
2-970	4-F-Ph	4-Pyr	6,6-diF
2-971	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6,6-diF
2-972	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	6,6-diF
2 - 973	3-C1-Ph	4-Pyr	6, 6-diF
2-974	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6,6-diF
2-975	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	6,6-diF
2-976	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	6,6-diF
2-977	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6,6-diF
2-978	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	6,6-diF
2-979	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	6,6-diF
2-980	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	6,6-diF
2-981	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	6,6-diF
2-982	4-F-Ph	4-Pyr	2->CH <sub>2</sub>
2-983	4-F-Ph	4-Pyr	2->CHMe

2-984	4-F-Ph	4-Pyr	2->CHE t
2-985	4-F-Ph	4-Pyr	2->CHP r
2-986	4-F-Ph	4-Pyr	2->C (Me) <sub>2</sub>
2-987	4-F-Ph	4-Pyr	2->CHPh
2-988	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diPh
2-989	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-0 (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> 0-
2-990	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-OCH <sub>2</sub> C (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
2-991	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
2-992	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sup>3</sup> -
2-993	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sup>4</sup> -
2-994	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sup>5</sup> -
2-995	4-F-Ph	4-Pyr	2-MeS
2-996	4-F-Ph	4-Pyr	2-E t S
2-997	4-F-Ph	4-Pyr	2-PrS
2-998	4-F-Ph	4-Pyr	2-BuS
2-999	4-F-Ph	4-Pyr	$2-{\tt MeSO_2}$
2-1000	4-F-Ph	4-Pyr	2-Ph0
2-1001	4-C1-Ph	4-Pyr	1-Me
2-1002	4-C1-Ph	4-Pyr	1 –E t
2-1003	4-C1-Ph	4-Pyr	1-Pr
2-1004	4-C1-Ph	4-Pyr :	1,1-diMe
2-1005	4-C1-Ph	4-Pyr	2-Me
2-1006	4-C1-Ph	4-Pyr	2–E t
2-1007	4-Cl-Ph	4-Pyr	2-Pr
2-1008	4-C1-Ph	4-Pyr	2-Bu
2-1009	4-C1-Ph	4-Pyr	2-Allyl
2-1010	4-C1-Ph	4-Pyr	2-Ph
2-1011	4-C1-Ph	4-Pyr	2-Bn
2-1012	4-C1-Ph	4-Pyr	2-Phe t
2-1013	4-Cl-Ph	4-Pyr	2,2-diMe
2-1014	4-C1-Ph	4-Pyr	2-0H
2-1015	4-Cl-Ph	4-Pyr	2-MeO
2-1016	4-C1-Ph	4-Pyr	2-E t O
2-1017	4-C1-Ph	4-Pyr	2-Pr0
2-1018	4-C1-Ph	4-Pyr	2, 2-di (Me0)
2-1019	4-Cl-Ph	4-Pyr	2, 2-di (Et0)

2-1020	4-C1-Ph	4-Pyr	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
2-1021	4-C1-Ph	4-Pyr	2-0xo
2-1022	4-C1-Ph	4-Pyr	2-F
2-1023	4-C1-Ph	4-Pyr	2-C1
2-1024	4-C1-Ph	4-Pyr	2-Br
2-1025	4-C1-Ph	4-Pyr	2-I
2-1026	4-C1-Ph	4-Pyr	2, 2-d i F
2-1027	4-C1-Ph	4-Pyr	2, 2-diCl
2-1028	4-Cl-Ph	4-Pyr	2, 2-diBr
2-1029	4-C1-Ph	4-Pyr	3-Me
2-1030	4-C1-Ph	4-Pyr	3-E t
2-1031	4-C1-Ph	4-Pyr	3-P r
2-1032	4-C1-Ph	4-Pyr	3,3-diMe
2-1033	4-C1-Ph	4-Pyr	5-Me
2-1034	4-C1-Ph	4-Pyr	5-E t
2-1035	4-C1-Ph	4-Pyr	5-Pr
2-1036	4-Cl-Ph	4-Pyr	5,5-diMe
2-1037	4-C1-Ph	4-Pyr	6-Ме
2-1038	4-C1-Ph	4-Pyr	6-E t
2-1039	4-Cl-Ph	4-Pyr	6-Pr
2-1040	4-Cl-Ph	4-Pyr	6,6-diMe
2-1041	4-C1-Ph	4-Pyr	6-0xo
2-1042	4-C1-Ph	4-Pyr	8-Me
2-1043	4-C1-Ph	4-Pyr	8-E t
2-1044	4-C1-Ph	4-Pyr	8-Pr
2-1045	4-C1-Ph	4-Pyr	8-Ph
2-1046	4-C1-Ph	4-Pyr	8a-Me
2-1047	4-C1-Ph	4-Pyr	8a-Et
2-1048	4-Cl-Ph	4-Pyr	8a-Pr
2-1049	4-C1-Ph	4-Pyr	$6, 6-(CH_2)_2-$
2-1050	4-C1-Ph	4-Pyr	6,6-diF
2-1051	4-C1-Ph	4-Pyr	2->CH <sub>2</sub>
2-1052	4-C1-Ph	4-Pyr	2->CHMe
2-1053	4-C1-Ph	4-Pyr	2->CHE t
2-1054	4-C1-Ph	4-Pyr	2->CHPr
2-1055	4-C1-Ph	4-Pyr	2->C (Me) <sub>2</sub>
			_

2-1056	4-Cl-Ph	4-Pyr	2->CHPh
2-1057	4-Cl-Ph	4-Pyr	2, 2-diPh
2-1058	4-Cl-Ph	4-Pyr	2, 2-0 (CH <sub>2</sub> ) 30-
2-1059	4-Cl-Ph	4-Pyr	2, 2-OCH <sub>2</sub> C (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
2-1060	4-C1-Ph	4-Pyr	$2, 2-(CH_2)_2-$
2-1061	4-Cl-Ph	4-Pyr	$2, 2-(CH_2)_3-$
2-1062	4-Cl-Ph	4-Pyr	$2, 2-(CH_2)_4-$
2-1063	4-C1-Ph	4-Pyr	$2, 2-(CH_2)_5-$
2-1064	4-Cl-Ph	4-Pyr	2-MeS
2-1065	4-Cl-Ph	4-Pyr	2-EtS
2-1066	4-Cl-Ph	4-Pyr	2-PrS
2-1067	4-Cl-Ph	4-Pyr	2-BuS
2-1068	4-C1-Ph	4-Pyr	$2-MeSO_2$
2-1069	4-Cl-Ph	4-Pyr	2-Ph0
2-1070	4-F-Ph	4-Pyr	2-(4-MeO-Ph)
2-1071	4-F-Ph	4-Pyr	2-(4-Me-Ph)
2-1072	4-F-Ph	4-Pyr	2-(4-F-Ph)
2-1073	4-F-Ph	4-Pyr	$2-(4-CF_3-Ph)$
2-1074	4-F-Ph	4-Pyr	2-(4-C1-Ph)
2-1075	4-F-Ph	4-Pyr	2-(2, 4-diF-Ph)
2-1076	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-(4-MeO-Ph)
2-1077	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-(4-Me-Ph)
2-1078	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-(4-F-Ph)
2-1079	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
2-1080	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-(4-C1-Ph)
2-1081	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr .	2-(2, 4-diF-Ph)
			•

化合物番号	R¹	R²	R <sup>5</sup>
3-1	Ph	4-Pyr	1-Me
3-2	Ph	4-Pyr	1-E t
3-3	Ph	4-Pyr	1-Pr
3-4	Ph	4-Pyr	1,1-diMe
3-5	Ph	4-Pyr	2-Me
3-6	Ph	4-Pyr	2-E t
3-7	Ph	4-Pyr	2-Pr
3-8	Ph	4-Pyr	2-Bu
3-9	Ph	4-Pyr	2-A11y1
3-10	Ph	4-Pyr	2-Ph
3-11	Ph	4-Pyr	2-Bn
3-12	Ph	4-Pyr	2-Phe t
3-13	Ph	4-Pyr	2,2-diMe
3-14	Ph	4-Pyr	2-OH
3-15	Ph	4-Pyr	2-Me0
3-16	Ph	4-Pyr	2-E t O
3-17	Ph	4-Pyr	2-Pr0
3-18	Ph	4-Pyr	2, 2-di (MeO)
3-19	Ph	4-Pyr	2, 2-di (EtO)
3-20	Ph	4-Pyr	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
3-21	Ph	4-Pyr	2-0xo
3-22	Ph	4≏Pyr	2-F
3-23	Ph	4-Pyr	2-C1
3-24	Ph	4-Pyr	2-Br
3-25	Ph	4-Pyr	2-I
3-26	Ph	4-Pyr	2, 2-diF
3-27	Ph	4-Pyr	2, 2-diCl
3-28	Ph	4-Pyr	2, 2-diBr
3-29	Ph	4-Pyr	3-Me
3-30	Ph	4-Pyr	3-Et
3-31	Ph	4-Pyr	3-Pr
3-32	Ph	4-Pyr	3, 3-d i Me
3-33	Ph	4-Pyr	5-Me

3-34	Ph	4-Pyr	5-E t
3-35	Ph	4-Pyr	5-Pr
3-36	Ph	4-Pyr	5,5-diMe
3-37	Ph	4-Pyr	6-Me
3-38	Ph	4-Pyr	6-Et
3-39	Ph	4-Pyr	6-Pr
3-40	Ph	4-Pyr	6,6-diMe
3-41	Ph	4-Pyr	6-0xo
3-42	Ph	4-Pyr	8a-Me
3-43	. Ph	4-Pyr	8a-Et
3-44	Ph	4-Pyr	8a-Pr
3-45	3-F-Ph	4-Pyr	1-Me
3-46	3-F-Ph	4-Pyr	1-Et
3-47	3-F-Ph	4-Pyr	1-Pr
3-48	3-F-Ph	4-Pyr	1,1-diMe
3-49	3-F-Ph	4-Pyr	2-Me
3-50	3-F-Ph	4-Pyr	2-E t
3-51	3-F-Ph	4-Pyr	2-Pr
3-52	3-F-Ph	4-Pyr	2-Bu
3-53	3-F-Ph	4-Pyr	2-Allyl
3-54	3-F-Ph	4-Pyr	2-Ph
3-55	3-F-Ph	4-Pyr	2-Bn
3-56	3-F-Ph	4-Pyr	2-Phet
3-57	3-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diMe
3-58	3-F-Ph	4-Pyr	2-0H
3-59	3-F-Ph	4-Pyr	2-Me0
3-60	3-F-Ph	4-Pyr	2-Et0
3-61	3-F-Ph	4-Pyr	2-Pr0
3-62	3-F-Ph	4-Pyr	2, 2-di (MeO)
3-63	3-F-Ph	4-Pyr	2, 2-di (EtO)
3-64	3-F-Ph	4-Pyr	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
3-65	3-F-Ph	4-Pyr	2-0x0
3-66	3-F-Ph	4-Pyr	2-F
3-67	3-F-Ph	4-Pyr	2-C1
3-68	3-F-Ph	4-Pyr	2-Br
3-69	3-F-Ph	4-Pyr	2-I

3-70	3-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diF
3-71	3-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diC1
3-72	3-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diBr
3-73	3-F-Ph	4-Pyr	3-Me
3-74	3-F-Ph	4-Pyr	3-E t
3-75	3-F-Ph	4-Pyr	3-Pr
3-76	3-F-Ph	4-Pyr	3,3-diMe
3-77	3-F-Ph	4-Pyr	5-Me
3-78	3-F-Ph	4-Pyr	5-E t
3-79	3-F-Ph	4-Pyr	5-Pr
3-80	3-F-Ph	4-Pyr	5,5-diMe
3-81	3-F-Ph	4-Pyr	6-Me
3-82	3-F-Ph	4-Pyr	6-Et
3-83	3-F-Ph	4-Pyr	6-Pr
3-84	3-F-Ph	4-Pyr	6,6-diMe
3-85	3-F-Ph	4-Pyr	6-0xo
3-86	3-F-Ph	4-Pyr	8a-Me
3-87	3-F-Ph	4-Pyr	8a-Et
3-88	3-F-Ph	4-Pyr	8a-Pr
3-89	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me
3-90	4-F-Ph	4-Pyr	1-E t
3-91	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr
3-92	4-F-Ph	4-Pyr	1,1-diMe
3-93	4-F-Ph	4-Pyr	2-Me
3-94	4-F-Ph	4-Pyr	2–E t
3-95	4-F-Ph	4-Pyr	2-Pr
3-96	4-F-Ph	4-Pyr	2-Bu
3-97	4-F-Ph	4-Pyr	2-Allyl
3-98	4-F-Ph	4-Pyr	2-Ph
3-99	4-F-Ph	4-Pyr	2-Bn
3-100	4-F-Ph	4-Pyr	2-Phe t
3-101	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diMe
	4-F-Ph	4-Pyr	2-0H
	4-F-Ph	4-Pyr	2-Me0
3-104	4-F-Ph	4-Pyr	2-Et0
3-105	4-F-Ph	4-Pyr	2-Pr0

3-106	4-F-Ph	4-Pyr		2, 2-di (MeO)
3-107	4-F-Ph	4-Pyr		2, 2-di (EtO)
3-108	4-F-Ph	4-Pyr		2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
3-109	4-F-Ph	4-Pyr		2-0xo
3-110	4-F-Ph	4-Pyr		2-F
3-111	4-F-Ph	4-Pyr		2-C1
3-112	4-F-Ph	4-Pyr		2-Br
3-113	4-F-Ph	4-Pyr	•	2-I
3-114	4-F-Ph	4-Pyr	•	2,2-diF
3-115	4-F-Ph	4-Pyr	•	2,2-diCl
3-116	4-F-Ph	4-Pyr		2,2-diBr
3-117	4-F-Ph	4-Pyr		3-Me
3-118	4-F-Ph	4-Pyr		3-E t
3-119	4-F-Ph	4-Pyr		3-Pr
3-120	4-F-Ph	4-Pyr		3,3-diMe
3-121	4-F-Ph	4-Pyr		5-Me
3-122	4-F-Ph	4-Pyr		5-E t
3-123	4-F-Ph	4-Pyr		5-Pr
3-124	4-F-Ph	4-Pyr		5,5-diMe
3-125	4-F-Ph	4-Pyr		6-Me
3-126	4-F-Ph	4-Pyr		6-E t
3-127	4-F-Ph	4-Pyr		6-Pr
3-128	4-F-Ph	4-Pyr		6,6-diMe
3-129	4-F-Ph	4-Pyr		6-0xo
3-130	4-F-Ph	4-Pyr		·8a-Me
3-131	4-F-Ph	4-Pyr		8a-Et
3-132	4-F-Ph	4-Pyr		8a-Pr
3-133	3-C1-Ph	4-Pyr		1-Me
3-134	3-C1-Ph	4-Pyr		1-Et
3-135	3-C1-Ph	4-Pyr		1-Pr
3-136	3-C1-Ph	4-Pyr	•	1,1-diMe
3-137	3-C1-Ph	4-Pyr		2-Me
3-138	3-C1-Ph	4-Pyr		2-E t
3-139	3-C1-Ph	4-Pyr		2-Pr
3-140	3-C1-Ph	4-Pyr		2-Bu
3-141	3-Cl-Ph	4-Pyr		2-Allyl

3-14	2 3-C1-Ph	4-Pyr	2-Ph
3-14	3 3-C1-Ph	4-Pyr	2-Bn
3-14	4 3-C1-Ph	4-Pyr	2-Phe t
3-14	5 3-C1-Ph	4-Pyr	2, 2-diMe
3-146	6 3-C1-Ph	4-Pyr	2-ОН
3-147	7 3-C1-Ph	4-Pyr	2-Me0
3-148	3-C1-Ph	4-Pyr	2-Et0
3-149	3-C1-Ph	4-Pyr	· 2-Pr0
3-150	3-C1-Ph	4-Pyr	2, 2-di (MeO)
3-151	3-C1-Ph	4-Pyr	2, 2-di (EtO)
3-152	3-C1-Ph	4-Pyr	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O
3-153	3-C1-Ph	4-Pyr	2-0xo
3-154	3-CI-Ph	4-Pyr	2-F
3-155	3-C1-Ph	4-Pyr	2-C1
3-156	3-C1-Ph	4-Pyr	2-Br
3-157	3-C1-Ph	4-Pyr	2-I
3-158	3-C1-Ph	4-Pyr	2, 2-diF
3-159	3-C1-Ph	4-Py <b>r</b>	2, 2-diCl
3-160	3-C1-Ph	4-Pyr	2,2-diBr
3-161	3-C1-Ph	4-Pyr	3-Me
3-162	3-C1-Ph	4-Pyr	3–E t
3-163		4-Pyr	3-Pr
	3-C1-Ph	4-Pyr	3,3-diMe
	3-C1-Ph	4-Pyr	5-Me
	3-C1-Ph	4-Pyr	5-E t
	3-C1-Ph	4-Pyr	5-Pr
3-168	3-C1-Ph	4-Pyr	5, 5-diMe
3-169	3-C1-Ph	4-Pyr	6-Me
3-170	3-C1-Ph	4-Pyr	6-Et ,
3-171	3-C1-Ph	4-Pyr	6-Pr
3-172		4-Pyr	6,6-diMe
3-173	3-Cl-Ph	4-Pyr	6-0xo
	3-C1-Ph	4-Pyr	8a-Me
3-175	3-Cl-Ph	4-Pyr	8a-Et
3-176	3-C1-Ph	4-Pyr	8a-Pr
3-177	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	1-Me

3-178	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	1-E t
3-179	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	1-Pr
3-180	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	1,1-diMe
3-181	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Me
3-182	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2–E t
3-183	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Pr
3-184	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Bu
3-185	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Allyl
3-186	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Ph
3-187	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Bn
3-188	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Phe t
3-189	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	2, 2-diMe
3-190	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	2-ОН
3-191	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Me0
3-192	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	2-Et0
3-193	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-Pr0
3-194	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2,2-di(MeO)
3-195	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	2, 2-di (Et0)
3-196	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O
3-197	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	2-0x0
3-198	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	2-F
3-199	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	2-C1
3-200	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	2-Br
3-201	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2-I
3-202	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2, 2-diF
3-203	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2, 2-diCl
3-204	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	2, 2-diBr
3-205	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	3-Ме
3-206	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	3-E t
3-207	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	3-Pr
3-208	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	3,3-diMe
3-209	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	5-Me
3-210	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	5-E t
3-211	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	5-Pr
3-212	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	5,5-diMe
3-213	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	6-Me

3-214	4 3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	C D+
3-215			6-E t
	$3-CF_3-Ph$		6-Pr
	$3 - CF_3 - Ph$		6,6-diMe
3-218			6-0xo
			8a-Me
	3-CF <sub>3</sub> -Ph	_	8a-Et
	3-CF <sub>3</sub> -Ph		8a-Pr
3-221	•		1-Me
	3, 4-diF-Ph		1-Et
	3, 4-diF-Ph		1-Pr
	3, 4-diF-Ph		1,1-diMe
	3, 4-diF-Ph		2-Me
	3, 4-diF-Ph	_	2–E t
3-227	•		2-P r
	3, 4-diF-Ph		2–Bu
	3, 4-diF-Ph		2-Allyl
3-230		-	2-Ph
	3, 4-d i F-Ph		2-Bn
3-232	•		2-Phet
	3,4-diF-Ph		2,2-diMe
3-234	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2-ОН
3-235	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	2-MeO
3-236	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	2-E t O
3-237	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	2-Pr0
3-238	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	2, 2-di (MeO)
3-239	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	2, 2-di (Et0)
3-240	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
3-241	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	2-0x0
3-242	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	2-F
3-243	3,4-diF-Ph	4-Py <b>r</b>	2-C1
3-244	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2-Br
3-245	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	2-I
3-246	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2, 2-diF
3-247	3,4-diF-Ph	4-Pyr	2, 2-diC1
3-248	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	2, 2-diBr
3-249	3,4-diF-Ph	4-Pyr	3-Me

3-250	3, 4-diF-Ph	4-Pyr		3-E t		
3-251	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr		3-Pr		
3-252	3, 4-diF-Ph	4-Pyr		3,3-diMe		
3-253	3,4-diF-Ph	4-Pyr		5-Me		
3-254	3,4-diF-Ph	4-Pyr		5-E t		
3-255	3, 4-diF-Ph	4-Pyr		5-Pr		
3-256	3,4-diF-Ph	4-Pyr		5,5-diMe		
3-257	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	62. j	6-Me	÷ 15.	
3-258	3, 4-diF-Ph	4-Pyr		6-Et		
3-259	3, 4-diF-Ph	4-Pyr		6-Pr		
3-260	3,4-diF-Ph	4-Pyr		6,6-diMe	•	
3-261	3, 4-diF-Ph	4-Pyr		6-0xo		
3-262	3,4-diF-Ph	4-Pyr		8a-Me		
3-263	3,4-diF-Ph	4-Pyr		8a-Et		
3-264	3,4-diF-Ph	4-Pyr		8a-Pr		
3-265	Ph	4-Pyr		$6, 6-(CH_2)_2-$		
3-266	3-F-Ph	4-Pyr		$6, 6-(CH_2)_2-$		
3-267	4-F-Ph	4-Pyr		$6, 6-(CH_2)_2-$		
3-268	3-C1-Ph	4-Pyr		$6, 6-(CH_2)_2-$		
3-269	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr		$6, 6-(CH_2)_2-$		
3-270	3,4-diF-Ph	4-Pyr		6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -····	* .* .	·· · .
3-271	Ph	4-Pyr		6,6-diF		
3-272	3-F-Ph	4-Pyr		6,6-diF		
3 - 273	4-F-Ph	4-Pyr		6,6-diF		
3-274	3-C1-Ph	4-Pyr		6,6-diF		
3-275	· ·	4-Pyr		6,6-diF		
3-276	3, 4-diF-Ph	4-Pyr		6,6-diF		
					-	

表 4

化合4番	物 R¹ 号	R²	R 5
	<del></del>		
4-1	4-F-Ph	4-Pyr	2-Me
4-2	4-F-Ph	4-Pyr	2-E t
4-3	4-F-Ph	4-Pyr	2-Pr
4-4	4-F-Ph	4-Pyr	2-Bu
4-5	4-F-Ph	4-Pyr	2-Allyl
4-6	4-F-Ph	4-Pyr	2-Ph
4-7	4-F-Ph	4-Pyr	2-Bn
4-8	4-F-Ph	4-Pyr	2-Phet
4-9	4-F-Ph	4-Pyr	3-Me
4-10	4-F-Ph	4-Pyr	3-E t
4-11	4-F-Ph	4-Pyr	3-Pr
4-12	4-F-Ph	4-Pyr	3,3-diMe
4-13	4-F-Ph	4-Pyr	5-Me
4-14	4-F-Ph	4-Pyr	5-E t
4-15	4-F-Ph	4-Pyr	5-Pr
4-16	4-F-Ph	4-Pyr	5,5-diMe
4-17	4-F-Ph	4-Pyr	· 6-Me
4-18	4-F-Ph	4-Pyr	6-E t
4-19	4-F-Ph	4-Pyr	6-Pr
4-20	4-F-Ph	4-Pyr	6,6-diMe
4-21	4-F-Ph	4-Pyr	$6, 6-(CH_2)_2-$
4-22	4-F-Ph	4-Pyr	6-0xo
4-23	4-F-Ph	4-Pyr	8-Me
4-24	4-F-Ph	4-Pyr	8-Et
4-25	4-F-Ph	4-Pyr	8-Pr
4-26	4-F-Ph	4-Pyr	8-Ph
4-27	4-F-Ph	4-Pyr	8a-Me
4-28	4-F-Ph	4-Pyr	8a-Et
4-29	4-F-Ph	4-Pyr	8a-Pr
4-30	4-F-Ph	4-Pyr	2-Н

化合物	勿 R <sup>1</sup>	$\mathbb{R}^2$	R <sup>6</sup>	,	<sup>™</sup> •.*
	弓		•		
5-1	4-F-Ph	4-Pyr	1-Me		
5-2	4-F-Ph	4-Pyr	1-E t		
5-3	4-F-Ph	4-Pyr	1-Pr		
5-4	4-F-Ph	4-Pyr	1,1-diMe		
5-5	4-F-Ph	4-Pyr	2-Me		
5-6	4-F-Ph	4-Pyr	2–E t		
5-7	4-F-Ph	4-Pyr	2-Pr		
5-8	4-F-Ph	4-Pyr	2-Bu		
5-9	4-F-Ph	4-Pyr	2-Allyl		
5-10	4-F-Ph	4-Pyr	2-Ph	- •	6 1 L
5-11	4-F-Ph	4-Pyr	2-Bn		
5-12	4-F-Ph	4-Pyr	2-Phet		
5-13	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-d i Me		
5-14	4-F-Ph	4-Pyr	2-0H		
5-15	4-F-Ph	4-Pyr	2-MeO		
5-16	4-F-Ph	4-Pyr	2-EtO		
5-17	4-F-Ph	4-Pyr	2-Pr0		
5-18	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-di (MeO)		•
5-19	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-di (Et0)		
5-20	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-		
5-21	4-F-Ph	4-Pyr	2-0xo		
5-22	4-F-Ph	4-Pyr	2-F		
5-23	4-F-Ph	4-Pyr	2-C1		
5-24	4-F-Ph	4-Pyr	2-Br		
5-25	4-F-Ph	4-Pyr	2-1		

5-26	4-F-Ph	4-Pyr	2,2-diF
5-27	4-F-Ph	4-Pyr	2,2-diCl
5-28	4-F-Ph	4-Pyr	2, 2-diBr
5-29	4-F-Ph	4-Pyr	3-Ме
5-30	4-F-Ph	4-Pyr	3-Et
5-31	4-F-Ph	4-Pyr	3-Pr
5-32	4-F-Ph	4-Pyr	3,3-diMe
5-33	4-F-Ph	4-Pyr	5-Me
5-34	4-F-Ph	4-Pyr	5-E t
5-35	4-F-Ph	4-Pyr	5-Pr
5-36	4-F-Ph	4-Pyr	5,5-diMe
5-37	4-F-Ph	4-Pyr	6-Me
5-38	4-F-Ph	4-Pyr	6-Et
5-39	4-F-Ph	4-Pyr	6-Pr
5-40	4-F-Ph	4-Pyr	6-Ph
5-41	4-F-Ph	4-Pyr	8-Ме
5-42	4-F-Ph	4-Pyr	8-Et
5-43	4-F-Ph	4-Pyr	8-Pr
5-44	4-F-Ph	4-Pyr	8,8-diMe
5-45	4-F-Ph	4-Pyr	8, 8-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
5-46	4-F-Ph	4-Pyr	8-0xo
5-47	4-F-Ph	4-Pyr	8a-Me
5-48	4-F-Ph	4-Pyr	8a-Et
5-49	4-F-Ph	4-Pyr	8a-Pr
5-50	4-F-Ph	4-Pym	2->CH <sub>2</sub>
5-51	4-F-Ph	4-Pym	2->CHMe
5-52	4-F-Ph	4-Pym	2->CHE t
5-53	4-F-Ph	4-Pym	2->CHP r
5-54	4-F-Ph	4-Pym	$2->C$ (Me) $_2$
5-55		4-Pym	2->CHPh
5-56	4-F-Ph	4-Pym	2, 2-d i Ph
5-57	4-F-Ph	4-Pym	$2, 2-0 (CH_2)_30-$
	4-F-Ph	4-Pym	$2, 2-0 \text{CH}_2 \text{C (Me)}_2 \text{CH}_2 0-$
5-59		4-Pym	$2, 2-(CH_2)_2-$
5-60	4-F-Ph	4-Pym	$2, 2-(CH_2)_3-$
5-61	4-F-Ph	4-Pym	$2, 2-(CH_2)_4-$

5-62	4-F-Ph.	4-Pym	$2, 2-(CH_2)_5-$
5-63	4-F-Ph	4-Pym	2-MeS
5-64	4-F-Ph	4-Pym	2-EtS
5-65	4-F-Ph	4-Pym	2-PrS
5-66	4-F-Ph	4-Pym	2-BuS
5-67	4-F-Ph	4-Pym	2-MeSO <sub>2</sub>
5-68	4-F-Ph	4-Pym	2-Ph0

/ A #/		T	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
化合物 番 号	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>
6-1	4-F-Ph	4-Pyr	
6-2	4-F-Ph	4-Pyr	
6 – 3	4-F-Ph	4-Pyr	
6 – 4	4-F-Ph	4-Pyr	
6 — 5	4-F-Ph	4-Pyr	H <sub>3</sub> C N
6 – 6	4-F-Ph	4-Pyr	H <sub>3</sub> C N
6 – 7	4-F-Ph	4-Pyr	
6 – 8	4-F-Ph	4-Pyr	

表 
$$7$$

$$R^{2}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{1}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{5}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{5}$$

$$R^{1}$$

$$R^{2}$$

$$R^{3}$$

$$R^{4}$$

$$R^{5}$$

$$R^{1}$$

化合物		R²	R <sup>5</sup>	
7-1	4-F-Ph	4-Pyr	2-Me	_
7-2	4-F-Ph	4-Pyr	2-E t	
7-3	4-F-Ph	4-Pyr	2-Pr	
7-4	4-F-Ph	4-Pyr	2-Bu	
7-5	4-F-Ph	4-Pyr	2-Allyl	
7-6	4-F-Ph	4-Pyr	2-Ph	
7-7	4-F-Ph	4-Pyr	2-Bn	
7-8	4-F-Ph	4-Pyr	2-Phet	
7-9	4-F-Ph	4-Pyr	3-Me	
7-10	4-F-Ph	4- <b>P</b> y <b>r</b>	3-Et	
7-11	4-F-Ph	4-Pyr	3-Pr	
7-12	4-F-Ph	4-Pyr	. 3,3-diMe	
7-13	4-F-Ph	4-Pyr	5-Me	
7-14	4-F-Ph	4-Pyr	5-E t	
7-15	4-F-Ph	4-Pyr	5-Pr	
7-16	4-F-Ph	4-Pyr	5,5-diMe	
7-17	4-F-Ph	4-Pyr	6-Me	
7-18	4-F-Ph	4-Pyr	6-Et	
7-19	4-F-Ph	4-Pyr	6-Pr	
7-20	4-F-Ph	4-Pyr	6,6-diMe	
7-21	4-F-Ph	4-Pyr	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
7-22	4-F-Ph	4-Pyr	6-0xo	
7-23	4-F-Ph	4-Pyr	8-Me	
7-24	4-F-Ph	4-Pyr	8–E t	
7-25	4-F-Ph	4-Pyr	8-Pr	

7-29	4-F-Ph	4-Pyr	8a-Pr
7-28	4-F-Ph	4-Pyr	8a-Et
7-27	4-F-Ph	4-Pyr	8a-Me
7-26	4-F-Ph	4-Pyr	8-Ph

化合物	$\mathbb{R}^1$	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
番 号		-		
8-1	Ph	4-Pyr	Н	Н
8-2	Ph	4-Pyr	H	1-Me
8-3	Ph	4-Pyr	Н	1-E t
8-4	Ph	4-Pyr	Н	1-Pr
8-5	Ph	4-Pyr	H	1,1-diMe
8-6	Ph	4-Pyr	H	2-Me
8 <b>-</b> 7 ·	Ph	4-Pyr	H	2-E t
8-8	Ph	4-Pyr	H	2-Pr
8-9	Ph	4-Pyr	H	2-Bu
8-10	Ph	4-Pyr	H	2-Allyl
8-11	Ph	4-Pyr	H	2-Ph
8-12	Ph	4-Pyr	H	2-Bn
8-13	Ph	4-Pyr	H	2-Phe t
8-14	Ph	4-Pyr	Н	2, 2-diMe
8-15	Ph	4-Pyr	H	2-0H
8-16	Ph	4-Pyr	H	2-Me0
8-17	Ph	4-Pyr	H	2-Et0

8-18	Ph	4-Pyr	Н	2-Pr0
8-19	Ph	4-Pyr	Н	2, 2-di (MeO)
8-20	Ph	4-Pyr	H	.2, 2-di (Et0)
8-21	Ph	4-Pyr	H	2, 2-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
8-22	Ph	4-Pyr	Н	2-0x0· · · ·
8-23	Ph	4-Pyr	Н	2-F
8-24	Ph	4-Pyr	H	2-C1
8-25	Ph	4-Pyr	. • Н	2-Br
8-26	Ph	4-Pyr	H	2-I
8-27	Ph	4-Pyr	: <b>H</b>	2, 2-diF
8-28	Ph	4-Pyr	Н	2, 2-diCl
8-29	Ph	4-Pyr	H	2,2-diBr
8-30	Ph	4-Pyr	H	3-Ме
8-31	Ph	4-Pyr	H	3-E t
8-32	Ph	4-Pyr	H	3-Pr
8-33	Ph	4-Pyr	H	3,3-diMe
8-34	Ph	4-Pyr	H	5-Me
8-35	Ph	4-Pyr	H	5-E t
8-36	Ph	4-Py r	H	5-Pr
8-37	Ph	4-Pyr	H	5,5-diMe
8-38	Ph	· 4-Pyr	Н	6-Me
8-39	Ph	4-Pyr	H	6−E t
8-40	Ph	4-Pyr	H	6-Pr
8-41	Ph	4-Pyr	H	6,6-diMe
8-42	Ph	4-Pyr	H	6,6-diF
8-43	Ph	4-Pyr	H	6,6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-44	Ph	4-Pyr	H	6-0xo
8-45	Ph	4-Pyr	H	8-Me
8-46	Ph ,	4-Pyr	H	8-E t
8-47	Ph	4-Pyr	H	8-Pr
8-48	Ph	4-Pyr	H	8-Ph
8-49	Ph	4-Pyr	H	8a-Me
8-50	Ph	4-Pyr	H	8a-Et
8-51	Ph	4-Pyr	Н	8a-Pr
8-52	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	H
8-53	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1-Me

8-54	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1-E t
8-55	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1-Pr
8-56	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	1,1-diMe
8-57	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Me
8-58	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2-E t
8-59	Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-Pr
8-60	Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-Bu
8-61	Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Н	2-Allyl
8-62	Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Н	2-Ph
8-63	Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-Bn
8-64	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2-Phet
8-65	Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Н	2,2-diMe
8-66	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2-ОН
8-67	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-MeO
8-68	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-E t O
8-69	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2-Pr0
8-70	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2,2-di(MeO)
8-71	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2, 2-di (EtO)
8-72	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H ·	2, 2-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
8-73	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-0xo
8-74	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2-F
8-75	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-C1
8-76	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2-Br
8-77	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-I
8-78	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-diF
8-79	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2,2-diCl
8-80	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-diBr
8-81	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3-Me
8-82	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3-E t
8-83	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	• Н	3-Pr
8-84	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3,3-diMe
8-85	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5-Me
8-86	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5–E t
8-87	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5-Pr
8-88	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5,5-diMe
8-89	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-Me

8-90	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	6-Et	
8-91	Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Н	6-Pr	_
8-92	Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Н	6,6-diMe.	
8-93	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	6,6-diF	
8-94	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	<b>. H</b>	6,6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	, •
8-95	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Η.	6-0xo	
8-96	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8-Me	
8-97	Ph -	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Start St.H.	8-Et	
8-98	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8-Pr	
8-99	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Ph	
8-100	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8a-Me	
8-101	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8a-Et	•
8-102	Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8a-Pr	
8-103	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	H	
8-104	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	1-Me	
8-105	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	1-E t	
8-106	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	1-Pr	
8-107	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	1,1-diMe	
8-108	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Me	
8-109	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-E t	
8-110	Ph	2-MeNH-4-Pym	<b> </b>	2-Pr	
8-111	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Bu	
8-112	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Allyl	
8-113	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Ph	
8-114	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Bn	
8-115	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Phet	
8-116	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2,2-diMe	
8-117	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-0H	
8-118	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-MeO	
8-119	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-E t O	
8-120	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Pr0	
8-121	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-di (MeO)	
8-122	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-di (Et0)	
8-123	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-	
8-124	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-0xo	
8-125	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-F	•

l

8-126	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-C1
8-127	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Br
8-128	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-I
8-129	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-diF
8-130	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-diCl
8-131	Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-diBr
8-132	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3-Me
8-133	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3-E t
8-134	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3-Pr
8-135	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3,3-diMe
8-136	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-Me
8-137	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-E t
8-138	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-Pr
8-139	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5,5-diMe
8-140	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-Me
8-141	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-E t
8-142	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-Pr
8-143	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6,6-diMe
8-144	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6,6-diF
8-145	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-146	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-0xo
8-147	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-Me
8-148	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-E t
8-149	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-Pr
8-150	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-Ph
8-151	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8a-Me
8-152	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8a-Et
8-153	Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8a-Pr
8-154	3-F-Ph	4-Pyr	H	H
8-155	3-F-Ph	4-Pyr	H	1-Me
8-156	3-F-Ph	4-Pyr	H	1-E t
8-157	3-F-Ph	4-Pyr	H	1-Pr
8-158	3-F-Ph	4-Pyr	H	1,1-diMe
8-159	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2-Me
8-160	3-F-Ph	4-Pyr	H	2-E t
8-161	3-F-Ph	4-Pyr	H	2-Pr

8-162	3-F-Ph	4-Pyr	. Н	2-Bu	
8-163	3-F-Ph	4-Pyr	• • Н	2-Allyl	
8-164	3-F-Ph	4-Руг	Н	2-Ph	
8-165	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2-Bn	
8-166	3-F-Ph	4-Pyr	. Н	2-Phe t	,
8-167	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-d iMe	
8-168	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2-0H	•
8-169	3-F-Ph	4-Pyr	· · · · H	2-MeO	, <b>(</b> )
8-170	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2-E t O	
8-171	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2-PrO	
8-172	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-di (MeO)	
8-173	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-di (EtO)	
8-174	3-F-Ph	4-Pyr	. Н	2, 2-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-	
8-175	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2-0xo	
8-176	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2-F	
8-177	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2-C1	
8-178	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2-Br	
8-179	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2-I	
8-180	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-d i F	
8-181	3-F-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-diCl	
8-182	3-F-Ph	4-Pyr	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	2,2-diBr ·	
8-183	3-F-Ph	4-Pyr	H	3-Me	
8-184	3-F-Ph	4-Pyr	Н	3-E t	
8-185	3-F-Ph	4-Pyr	. Н	3-Pr	
8-186	3-F-Ph	4-Pyr	H	3,3-diMe	
8-187	3-F-Ph	4-Pyr	H	5-Me	
8-188	3-F-Ph	4-Pyr	Н	5-E t	
8-189	3-F-Ph	4-Pyr	Н	5-Pr	
8-190	3-F-Ph	4-Pyr	Н	5,5-diMe	
8-191	3-F-Ph	4-Pyr	H	6-Me	
8-192	3-F-Ph	4-Pyr	· H	6-E t	
8-193	3-F-Ph	4-Pyr	Н ,	6-Pr	
8-194	3-F-Ph	4-Pyr	H	6,6-diMe	
8-195	3-F-Ph	4-Pyr	Н	6,6-diF	
8-196	3-F-Ph	4-Pyr	Н	6,6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	
8-197	3-F-Ph	4-Pyr	Н	6-0xo	

8-198	3-F-Ph	4-Pyr	Н	8-Me
8-199	3-F-Ph	4-Pyr	H	8-E t
8-200	3-F-Ph	4-Pyr	H	8-Pr
8-201	3-F-Ph	4-Pyr	Н	8-Ph
8-202	3-F-Ph	4-Pyr	H	8a-Me
8-203	3-F-Ph	4-Pyr	H	8a-Et
8-204	3-F-Ph	4-Pyr	H	8a-Pr
8-205	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	H
8-206	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	1-Me
8-207	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1-Et
8-208	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	1-Pr
8-209	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	1,1-diMe
8-210	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Me
8-211	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2–E t
8-212	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2-Pr
8-213	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Bu
8-214	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Allyl
8-215	3-F-Ph	$^{\prime}$ 2-NH $_2$ -4-Pym	Н	2-Ph
8-216	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Bn
8-217	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Phet
8-218	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2,2-diMe
8-219	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-0H
8-220	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Me0
8-221	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-E t O
8-222	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Pr0
8-223	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-di (MeO)
8-224	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-di (Et0)
8-225	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
8-226	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2-0xo
8-227	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-F
8-228	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-C1
8-229	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Br
8-230	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-I
8-231	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-diF
8-232	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	· H	2,2-diCl
8-233	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2,2-diBr

8-234	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3-Me
8-235	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	3-E t
8-236	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Н	3-Pr
8-237	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	3,3-diMe
8-238	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Н	5-Me
.8-239	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	5-E t
8-240	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	5-Pr
8-241	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Н	5,5-diMe
8-242	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	6-Me
8-243	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Н	6-E t
8-244	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Н	6-Pr
8-245	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6,6-diMe
8-246	3-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	·H	6,6-diF
8-247	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6,6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-248	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-0xo
8-249	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Me
8-250	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-E t
8-251	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Pr
8-252	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Ph
8-253	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8a-Me
8-254	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8a-Et
8-255	3-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8a-Pr
8-256	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	H
8-257	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	1-Me
8-258	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	·	1-E t
8-259	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	1-Pr
8-260	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	1,1-diMe
8-261	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Me
8-262	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-E t
8-263	3-F-Ph .	2-MeNH-4-Pym	H	2-Pr
8-264	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Bu
8-265	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Allyl
8-266	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Ph
8-267	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Bn
8-268	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Phet
8-269 ·	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2,2-diMe

8-270	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-0H
8-271	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-MeO
8-272	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-E t O
8-273	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Pr0
8-274	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-di (MeO)
8-275	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-di (Et0)
8-276	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
8-277	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-0xo
8-278	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-F
8-279	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-C1
8-280	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Br
8-281	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-I
8-282	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-d i F
8-283	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-diCİ
8-284	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-diBr
8-285	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3-Me
8-286	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3-E t
8-287	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3-Pr
8-288	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3,3-diMe
8-289	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-Me
8-290	3-F-Ph	. 2-MeNH-4-Pym	H	5-E t
8-291	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-Pr
8-292	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5,5-diMe
8-293	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-Me
8-294	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-E t
8-295	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-Pr
8-296	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6,6-diMe
8-297	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6,6-diF
8-298	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-299	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-0x0
8-300	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-Me
8-301	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-E t
8-302	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-Pr
8-303	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-Ph
8-304	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8a-Me
8-305	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8a-Et

8-306	3-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	8a-Pr
8-307	4-F-Ph	4-Pyr	. Н	Н
8-308	4-F-Ph	4-Pyr	Н	1-Me
8-309	4-F-Ph	4-Pyr	Н	1-E t
8-310	4-F-Ph	4-Pyr	Н	1-Pr
8-311	4-F-Ph	4-Pyr	H	1,1-diMe
8-312	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2-Me
8-313	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Et
8-314	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Pr
8-315	4-F-Ph	4-Pyr	. Н	2-Bu
8-316	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2-Allÿl
8-317	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2-Ph
8-318	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2-Bn
8-319	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2-Phet
8-320	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-diMe
8-321	4-F-Ph	4-Pyr ·	Н	2-OH
8-322	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Me0
8-323	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2-Et0
8-324	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2-Pr0
8-325	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-di (MeO)
8-326	4-F-Ph .	4-Pyr	- Н	2, 2-di (Et0)
8-327	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
8-328	4-F-Ph	4-Pyr	Н .	2-0xo
8-329	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2-F
8-330	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-C1
8-331	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Br
8-332	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2-I
8-333	4-F-Ph	4-Pyr	• Н	2, 2-diF
8-334	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-diCl
8-335	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-diBr
8-336	4-F-Ph	4-Pyr	H	3-Me
8-337	4-F-Ph	4-Pyr	H	3-E t
8-338	4-F-Ph	4-Pyr	H	3-Pr
8-339	4-F-Ph	4-Pyr	H	3, 3-diMe
8-340	4-F-Ph	4-Pyr	Н	5-Me
8-341	4-F-Ph	4-Pyr	H	5-Et

8-342	4-F-Ph	4-Pyr	H	5-Pr
8-343	4-F-Ph	4-Pyr	H	5,5-diMe
8-344	4-F-Ph	4-Pyr	Н	6-Me
8-345	4-F-Ph	4-Pyr	H	6-E t
8-346	4-F-Ph	4-Pyr	H	6-Pr
8-347	4- <b>F-</b> Ph	4-Pyr	· H	6,6-diMe
8-348	4-F-Ph	4-Pyr	Н	6,6-diF
8-349	4-F-Ph	4-Pyr	Н	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-350	4-F-Ph	4-Pyr	H	6-0x0
8-351	4-F-Ph	4-Pyr	H	8-Me
8-352	4-F-Ph	4-Pyr	H	8-E <sub>t</sub>
8-353	4-F-Ph	4-Pyr	H	8-Pr
8-354	4-F-Ph	4-Pyr	H	8-Ph
8-355	4-F-Ph	4-Pyr	H	8a-Me
8-356	4-F-Ph	4-Pyr	H	8a-Et
8-357	4-F-Ph	4-Pyr	H	8a-Pr
8-358	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	H
8-359	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1- <b>Me</b>
8-360	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1-E t
8-361	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1-Pr
8-362	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1,1-diMe
8-363	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Me
8-364	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-E t
8-365	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Pr
8-366	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Bu
8-367	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Allyl
8-368	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-Ph
8-369	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-Bn
8-370	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-Phet
8-371	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2,2-diMe
8-372	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-0H
8-373	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-Me0
8-374	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-E t O
8-375	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-Pr0
8-376	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2,2-di(MeO)
8-377	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-di (EtO)

8-378	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2, 2-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
8-379	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2-0xo
8-380	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Н	2-F
8-381	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-C1
8-382	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Br
8-383	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Н	2-I
8-384	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2, 2-diF
8-385	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	. Н	2, 2-diCl
8-386	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Н	2, 2-diBr
8-387	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3-Me
8-388	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	3-E t
8-389	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3-Pr
8-390	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3,3-diMe
8-391	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5-Me
8-392	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5–E t
8-393	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5-Pr
8-394	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5,5-diMe
8-395	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-Me
8-396	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-E t
8-397	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-Pr
8-398	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	· <b>H</b> ·	6,6-diMe-
8-399	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6,6-diF
8-400	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6,6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-401	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-0xo
8-402	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Me
8-403	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-E t
8-404	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8-Pr
8-405	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Ph
8-406	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8a-Me
8-407	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	. Н	8a-Et
8-408	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8a-Pr
8-409	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	H
8-410	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	1-Me
8-411	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	1-Et
8-412	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	1-Pr
8-413	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	1,1-diMe

8-414	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Me
8-415	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-E t
8-416	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Pr
8-417	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Bu
8-418	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Allyl
8-419	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Ph
8-420	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Bn
8-421	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Phet
8-422	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-diMe
8-423	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-ОН
8-424	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-MeO
8-425	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-E t O
8-426	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Pr0
8-427	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2,2-di(MeO)
8-428	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-di (Et0)
8-429	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
8-430	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-0xo
8-431	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-F
8-432	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-C1
8-433	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Br
8-434	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-I
8-435	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-diF
8-436	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-diCl
8-437	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-diBr
8-438	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3-Me
8-439	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3-E t
8-440	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3-Pr
8-441	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3,3-diMe
8-442	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-Me
8-443	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-E t
8-444	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-Pr
8-445	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5,5-diMe
8-446	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-Me
8-447	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-E t
8-448	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-Pr
8-449	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6,6-diMe

0 450	4 17 101				
8-450	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	6,6-diF	
8-451	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	; H	$6, 6-CH_2CH_2-$	
8-452	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	. Н	6-0xo	
8-453	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	8-Me	
8-454	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	. Н	8-Et	
8-455	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-Pr	
8-456	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	8-Ph	-
8-457	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H- (1.	8a-Me - 1-:	· 6 ,·
8-458	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	8a-Et	
8-459	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8a-Pr	
8-460	3-C1-Ph	4-Pyr	H	Н	
8-461	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	1-Me	
8-462	3-C1-Ph	4-Pyr	H	1-E t	
8-463	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	1-Pr	
8-464	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	1,1-diMe	
8-465	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-Me	
8-466	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-E t	
8-467	3-C1-Ph	4-Pyr	· H	2-Pr	
8-468	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-Bu	
8-469	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-Allyl	
8-470	3-C1-Ph .	4-Pyr	Н	2-Ph	
8-472	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-Bn	
8-472	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-Phet	
8-473	3-Cl-Ph	4-Pyr	H	2,2-diMe	
8-474	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-ОН	
8-475	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-MeO	
8-476	3-C1-Ph	4-Pyr	Н .	2-EtO	
8-477	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-Pr0	
8-478	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-di (MeO)	
8-479	3-C1-Ph	4-Pyr	H	2, 2-di (EtO)	
8-480	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-	
8-481	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-0xo	
8-482	3-C1-Ph	4-Pyr	. Н	2-F	
8-483	3-C1-Ph	4-Руг	H	2-C1	
8-484	3-C1-Ph	4-Pyr	H	2-Br	
8-485	3-C1-Ph	4-Pyr	Н.	2-I	
	•	•			

8-486	3-C1-Ph	4-Pyr	H	2, 2-diF
8-487	3-C1-Ph	4-Pyr	H	2, 2-diCl
8-488	3-C1-Ph	4-Pyr	H	2, 2-diBr
8-489	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	3-Me
8-490	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	3-E t
8-491	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	3-Pr
8-492	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	3,3-diMe
8-493	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	5-Me
8-494	3-C1-Ph	4-Pyr	H	5-Et
8-495	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	5-Pr
8-496	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	5,5-diMe
8-497	3-C1-Ph	4-Pyr	H	· 6-Me
8-498	3-C1-Ph	4-Pyr	Н .	6-E t
8-499	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	6-Pr
8-500	3-C1-Ph	4-Pyr	H	6,6-diMe
8-501	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	6,6-diF
8-502	3-C1-Ph	4-Pyr	H	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-503	3-C1-Ph	4-Pyr	H	6-0xo
8-504	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	8-Me
8-505	3-C1-Ph	4-Pyr	H	8-E t
8-506	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	8-Pr
8-507	3-C1-Ph	4-Pyr	H	8-Ph
8-508	3-C1-Ph	4-Pyr	H	8a-Me
8-509	3-C1-Ph	4-Pyr	H	8a-Et
8-510	3-C1-Ph	4-Pyr	Н	8a-Pr
8-511	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	H
8-512	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	1-Me
8-513	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1-E t
8-514	3-CI-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	1-Pr
8-515	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	1,1-diMe
8-516	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Me
8-517	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-E t
8-518	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2-Pr
8-519	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Bu
8-520	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Allyl
8-521	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Ph

8-522	3-C1-Ph .	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2-Bn	
8-523	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2-Phe t	•
8-524	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2,2-diMe	
8-525	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-0H	
8-526	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	. Н	2-MeO	
8-527	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	. Н	2-E t 0	
8-528	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2-Pr0	
8-529	3-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	. Н	2, 2-di (MeO)	·"
8-530	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-di (EtO)	
8-531	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-	
8-532	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-0xo	
8-533	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-F	
8-534	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-C1	
8-535	3-C1-Ph	$2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym}$	H	2-Br	
8-536	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-I	
8-537	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-d i F	
8-538	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-d i C l	
8-539	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-d i Br	
8-540	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3-Me	
8-541	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3-E t	
8-542	3-C1-Ph.	$2-NH_2-4-Pym$	$\dots, H_{k}$	3-Pr	
8-543	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3,3-diMe	
8-544	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5-Me	
8-545	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	5-E t	
8-546	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5-Pr	•
8-547	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5,5-diMe	
8-548	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-Me	
8-549	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	6-E t	
8-550	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-Pr	
8-551	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6,6-diMe	
8-552	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6,6-diF	•
8-553	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6,6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	
8-554	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-0x0	
8-555	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Me	
8-556	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-E t	
8-557	3-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Pr	

8-558	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8-Ph
8-559	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8a-Me
8-560	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8a-Et
8-561	3-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8a-Pr
8-562	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	H
8-563	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	1-Me
8-564	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	1-E f
8-565	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	1-Pr
8-566	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	1,1-diMe
8-567	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н.	2-Me
8-568	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-E t
8-569	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Pr
8-570	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2–Bu
8-571	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Allyl
8 - 572	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Ph
8-573	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Bn
8-574	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Phe t
8-575	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-diMe
8-576	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-ОН
8-577	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-MeO
8-578	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-EtO
8-579	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Pr0
8-580	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-di (MeO)
8-581	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-di (Et0)
8-582	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
8-583	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-0xo
8-584	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-F
8-585	3-Cl-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-C1
8-586	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Br
8-587	3-Cl-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-I
8-588	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-diF
8-589	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2,2-diCl
8-590	3-Cl-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-diBr
8-591	3-Cl-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3-Me
8-592	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3-Et
8-593	3-Cl-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3-Pr

8-594	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3,3-diMe
8-595	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	5-Me
8-596	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-E t
8-597	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-Pr
8-598	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5,5-diMe
8-599	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-Me
8-600	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-E t
8-601	3-C1-Ph .	2-MeNH-4-Pym	:: H	6-Pr
8-602	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6,6-diMe
8-603	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6,6-diF
8-604	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6,6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-605	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-0xo
8-606	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-Me
8-607	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	8-E t
8-608	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	8-P <b>r</b>
8-609	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-Ph
8-610	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8a-Me
8-611	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8a-E t
8-612	3-C1-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8a-Pr
8-613	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	H
8-614	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	. Н	1-Me
8-615	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	1-E t
8-616	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	1-Pr
8-617	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	1,1-diMe
8-618	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-Me
8-619	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-E t
8-620	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-Pr
8-621	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-Bu
8-622	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-Allyl
8-623	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-Ph
8-624	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-Bn
8-625	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-Phe t
8-626	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2,2-diMe
8-627	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-0H
8-628	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-Me0
8-629	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-Et0

8-630	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-Pr0
8-631	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Н	2,2-di(MeO)
8-632	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Η.	2, 2-di (Et0)
8-633	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Н	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
8-634	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Н	2-0xo
8-635	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Н	2-F
8-636	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-C1
8-637	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Н	2-Br
8-638	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-I
8-639	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Н	2, 2-diF
8-640	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	H	2, 2-diCl
8-641	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2, 2-diBr
8-642	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	3-Me
8-643	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	3-E t
8-644	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	3-Pr
8-645	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	Н	3,3-diMe
8-646	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	H	5-Me
8-647	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Н .	5-E t
8-648	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	5-Pr
8-649	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Н	5,5-diMe
8-650	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	Н	6-Me
8-651	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	6-E t
8-652	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	6- <b>P</b> r
8-653	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	6,6-diMe
8-654	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	6,6-diF
8-655	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	$6, 6-CH_2CH_2-$
8-656	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Н	6-0x0
8-657	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Н	8-Me
8-658	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	8-E t
8-659	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	8-Pr
8-660	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	8-Ph
8-661	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Н	8a-Me
8-662	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	8a-Et
8-663	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	8a-Pr
8-664	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	H
8-665	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1-Me

3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym		H	1-E t
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	1-Pr
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		Н	1,1-diMe
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		. Н	2-Me
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		. Н	2-E t
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		Н	2-Pr
3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym		Н	2-Bu
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		. H-	2-Ally1 -1
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		$\cdot \mathbf{H}$	2-Ph
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	2-Bn
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	2-Phet
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	2,2-diMe
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	2-0H
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	2-MeO
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	2-EtO
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	2-Pr0
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	2, 2-di (MeO)
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	2, 2-di (Et0)
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		Н	2-0xo
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		· <b>H</b> -	2-F
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	2-C1
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		Н	2-Br
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pyin$		H	2-I
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	2, 2-diF
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	2, 2-diCl
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	2, 2-diBr
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	3-Me
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	3-E t
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	3-Pr
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	3,3-diMe
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	5-Me
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	5–E t
3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym		H	5-Pr
.3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$		H	5,5-diMe
3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym}$		H	6-Me
	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$\begin{array}{llllllllllllllllllllllllllllllllllll$	3-CF <sub>3</sub> -Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym         3-CF <sub>3</sub> -Ph	$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$

WO 03/015781 PCT/JP02/08276

8-702	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	6-E t
8-703	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	Н	6-Pr
8-704	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	6,6-diMe
8-705	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	6,6-diF
8-706	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-707	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-0xo
8-708	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8-Me
8-709	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8-E t
8-710	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Pr
8-711	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Ph
8-712	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8a-Me
8-713	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8a-Et
8-714	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8a-Pr
8-715	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	H
8-716	. 3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	1-Me
8-717	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	1-E t
8-718	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	1-Pr
8-719	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	1,1-diMe
8-720	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Me
8-721	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-E t
8-722	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-P r
8-723	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Bu
8-724	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Allyl
8-725	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Ph
8-726	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Bn
8-727	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Phe t
8-728	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2,2-diMe
8-729	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-0H
8-730	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Me0
8-731	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-E t O
8-732	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Pr0
8-733	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-di (MeO)
8-734	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-di (EtO)
8-735	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
8-736	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-0xo
8-737	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-F

8-738	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-C1
8-739	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Br
8-740	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-I
8-741	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-diF
8-742	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-diCl
8-743	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2, 2-diBr
8-744	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	3-Me
8-745	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	3-E t
8-746	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	3-Pr
8-747	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	Η .	3,3-diMe
8-748	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-Me
8-749	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-E t
8-750	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-Pr
8-751	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5,5-diMe
8-752	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-Me
8-753	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	6-E t
8-754	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-Pr
8-755	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6,6-diMe
8-756	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6,6-diF
8-757	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-758	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6-0xo
8-759	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-Me
8-760	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-E t
8-761	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-Pr
8-762	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-Ph
8-763	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8a-Me
8-764	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8a-Et
8-765	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8a-Pr
8-766	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	H	H
8-767	3,4-diF-Ph	4-Pyr	H	1-Me
8-768	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	Н	1-E t
8-769	3,4-diF-Ph	4-Pyr	H	1-Pr
8-770	3,4-diF-Ph	4-Pyr	H	1,1-diMe
8-771	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	H	2-Me
8-772	3,4-diF-Ph	4-Pyr	H	2-E t
8-773	3,4-diF-Ph	4-Pyr	H	2-Pr

8-774	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	F	I 2-Bu
8-775	3,4-diF-Ph	4-Pyr	F	I 2-Allyl
8-776	3,4-diF-Ph	4-Pyr	F	I 2-Ph
8-777	3,4-diF-Ph	4-Pyr	H	I 2–Bn
8-778	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	Н	I 2-Phet
8-779	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	. Н	1 2,2-diMe
8-780	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	H	2-0H
8-781	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	Н	2-Me0
8-782	3,4-diF-Ph	4-Pyr	H	2-E t O
8-783	3,4-diF-Ph	4-Pyr	Н	2-Pr0
8-784	3,4-diF-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-di (MeO)
8-785	3,4-diF-Ph	4-Pyr	H	2, 2-di (EtO)
8-786	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	· H	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
8-787	3,4-diF-Ph	4-Pyr	Н	2-0xo
8-788	3,4-diF-Ph	4-Pyr	Н	2-F
8-789	3,4-diF-Ph	4-Pyr	Н	2-C1
8-790	3,4-diF-Ph	4-Pyr	Н	2-Br
8-791	3,4-diF-Ph	4-Pyr	Н	2-I
8-792	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-diF
8-793	3, 4-dìF-Ph	4-Pyr	Н	2,2-diCl
8-794	3,4-diF-Ph	4-Pyr	Н	2,2-diBr
8-795	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	Н	3-Me
8-796	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	Н	3-E t
8-797	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	. Н	3-Pr
8-798	3,4-diF-Ph	4-Pyr	H	3,3-diMe
8-799	3,4-diF-Ph	4-Pyr	H	5-Me
8-800	3,4-diF-Ph	4-Pyr	Н	5-E t
8-801	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	H	5-Pr
8-802	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	Н	5,5-diMe
8-803	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	H	6-Me
8-804	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	H	6-E t
8-805	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	H	6-Pr
8-806	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	H	6,6-diMe
8-807	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	H	6,6-diF
8-808	3,4-diF-Ph	4-Pyr	Н	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-809	3,4-diF-Ph	4-Pyr	H	6-0xo

8-810	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	H	8-Me	
8-811	3,4-diF-Ph	4-Pyr	H	8-E t	
8-812	3, 4-d i F-Ph	4-Pyr	. Н	8-Pr	
8-813	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	H	8-Ph	
8-814	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	H	8a-Me	
8-81-5	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	H	8a-Et	
8-816	3, 4-diF-Ph	4-Pyr	H	8a-Pr	•
8-817	3, 4-d i F-P.h	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	. Н.	Н .	
8-818	3,4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	1-Me	
8-819	3, 4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	1-E t	
8-820	3, 4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	1-Pr	
8-821	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1,1-diMe	
8-822	3, 4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-Me	
8-823	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-E t	
8-824	3, 4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-Pr	
8-825	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Bu	
8-826	3, 4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-Allyl	
8-827	3, 4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-Ph	
8-828	3, 4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-Bn	
8-829	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Phet	
8-830	3, 4-d i F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	. Н.	2,2-diMe	* t** *)
8-831	3, 4-d i F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-OH	
8-832	3, 4-d i F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Me0	
8-833	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Et0	
8-834	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Pr0	
8-835	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2,2-di(MeO)	
8-836	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-di (EtO)	
8-837	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-	
8-838	3,4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-0xo .	
8-839	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-F	
8-840	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-C1	
8-841	3, 4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-Br	
8-842	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-I	
8-843	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2,2-diF	
8-844	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2,2-diC1	
8-845	3, 4-diF-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2,2-diBr	

8-846	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3-Me
8-847	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	3-E t
8-848	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	3-Pr
8-849	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	3,3-diMe
8-850	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	5-Me
8-851	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	5-E t
8-852	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	5-Pr
8-853	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	5,5-diMe
8-854	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	6-Me
8-855	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	6-E t
8-856	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	6-Pr
8-857	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	6,6-diMe
8-858	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6,6-diF
8-859	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	6,6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-860	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-0xo
8-861	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Me
8-862	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-E t
8-863	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8-Pr
8-864	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8-Ph
8-865	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8a-Me
8-866	3, 4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	. Н	8a-Et
8-867	3,4-diF-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8a-Pr
8-868	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	H
8-869	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	1-Me
8-870	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	1-E t
8-871	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	1-Pr
8-872	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	1,1-diMe
8-873	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Me
8-874	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-E t
8-875	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Pr
8-876	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Bu
8-877	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	. <b>H</b>	2-Ally1
8-878	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Ph
8-879	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	2-Bn
8-880	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Phe t
8-881	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2,2-diMe

8-882	3, 4-d i F-Ph	2-MeNH-4-Pym	. Н	2-ОН	
8-883	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H		
8-884	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н		
8-885	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Pr0	
8-886	3, 4-d i F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н		
8-887	3, 4-d i F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н		
8-888	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	. Н		
8-889	3, 4-d i F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H.		a+ 7 2
8-890	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-F	
8-891	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	. Н	2-C1	
8-892	3, 4-d i F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-Br ·	
8-893	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2-I	
8-894	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	2, 2-diF	
8-895	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н		
8-896	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H		
8-897	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	. Н	3-Me	
8-898	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3-E t	
8-899	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3-Pr	
8-900	3, 4-d i F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	3,3-diMe	
8-901	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-Me	
8-902	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	· · · · r.H. ·	5-E t	
8-903	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	5-Pr	
8-904	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	5,5-diMe	
8-905	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	6-Me	
8-906	3, 4-diF-Ph	·2-MeNH-4-Pym	Н	6-E t	
8-907	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	6-Pr	
8-908	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6,6-diMe	
8-909	3, 4-d i F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6,6-diF	
8-910	3, 4-d i F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	
8-911	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	6-0xo	
8-912	3, 4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н.	8-Me	
8-913	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	8-E t	
8-914	3, 4-diF-Ph.	2-MeNH-4-Pym	Н	8-Pr	
8-915	3, 4-d i F-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8-Ph	
8-916	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	. Н	8a-Me	
8-917	3, 4-d i F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Н	8a-Et	

8-918	3,4-diF-Ph	2-MeNH-4-Pym	H	8a-Pr
8-919	4-F-Ph	4-Pyr	Me	Н
8-920	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Me
8-921	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-E t
8-922	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Pr
8-923	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1,1-diMe
8-924	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Me
8-925	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-E t
8-926	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr
8-927	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Bu
8-928	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-A11y1
8-929	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph
8-930	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Bn
8-931	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Phet
8-932	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diMe
8-933	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-0H
8-934	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Me0
8-935	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Et0
8-936	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr0
8-937	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (MeO)
8-938	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (Et0)
8-939	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
8-940	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-0xo
8-941	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-F
8-942	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-C1
8-943	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Br
8-944	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-I
8-945	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diF
8-946	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diCl
8-947	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diBr
8-948	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Me
8-949	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-E t
8-950	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Pr
8-951	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3,3-diMe
8-952	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Me
8-953	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Et
		,		

8-954	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Pr
8-955	4-F-Ph	4-Pyr	Me Me	· 5,5-diMe
8-956	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Me
8-957	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-E t
8-958	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Pr
8-959	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-diMe
8-960	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-diF
8-961	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-962	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-0xo
8-963	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Me
8-964	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-E t
8-965	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Pr
8-966	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Ph
8-967	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Me
8-968	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Et
8-969	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Pr
8-970	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	H
8-971	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-Me
8-972	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-E t
8-973	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-Pr
8-974	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me-	1,1-diMe
8-975	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Me
8-ÿ976	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-E t
8-977	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Pr
8-978	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Bu
8-979	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-A11y1
8-980	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Ph
8-981	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Bn
8-982	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Phet
8-983	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-diMe
8-984	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-OH
8-985	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-MeO
8-986	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-E t O
8-987	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Pr0
8-988	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-di (MeO)
8-989	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-di (Et0)

8-990	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
8-991	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-0xo
8-992	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-F
8-993	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-C1
8-994	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-Br
8-995	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-I ·
8-996	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2, 2-diF
8-997	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2, <b>2</b> -diCl
8-998	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-diBr
8-999	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	3-Me
8-1000	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	3-E t
8-1001	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	3-Pr
8-1002	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	3,3-diMe
8-1003	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5-Me
8-1004	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5-Et
8-1005	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5-Pr
8-1006	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5,5-diMe
8-1007	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-Ме
8-1008	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-E t
8-1009	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-Pr
8-1010	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6,6-diMe
8-1011	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6,6-diF
8-1012	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-1013	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-0xo
8-1014	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Me
8-1015	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-E t
8-1016	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Pr
8-1017	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Ph
8-1018	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Me
8-1019	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Et
8-1020	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Pr
8-1021	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	H
8-1022	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	1-Me
8-1023	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	1-E t
8-1024	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	1-Pr
8-1025	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	1,1-diMe

8-1026	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Me
8-1027	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-E t
8-1028	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Pr
8-1029	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Bu
8-1030	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	· Me	2-Ally1
8-1031	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Ph
8-1032	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Bn
8-1033	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	. Me	2-Phe t
8-1034	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2,2-diMe
8-1035	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-0H
8-1036	4-F-Ph.	2-MeNH-4-Pym	Me	2-MeO
8-1037	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-EtO
8-1038	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Pr0
8-1039	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2, 2-di (MeO)
8-1040	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2, 2-di (Et0)
8-1041	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
8-1042	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-0xo
8-1043	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-F
8-1044	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-C1
8-1045	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Br
8-1046	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-I ····
8-1047	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2,2-diF
8-1048	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2, 2-diCl
8-1049	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2,2-diBr
8-1050	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	3-Me
8-1051	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	3-E t
8-1052	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	3-Pr
8-1053	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	3,3-diMe
8-1054	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	5-Me
8-1055	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	5-Et
8-1056	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	5-Pr
8-1057	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	5,5-diMe
8-1058	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	6-Me
8-1059	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	6-E t
8-1060	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	6-Pr
8-1061	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	6,6-diMe
	•			

8-1062	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	6,6-diF
8-1063	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	6,6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
8-1064	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	6-0xo
8-1065	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	8-Me
8-1066	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	8-E t
8-1067	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	8-Pr
8-1068	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	8-Ph
8-1069	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	8a-Me
8-1070	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	8a-Et
8-1071	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	8a-Pr
8-1072	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	H	H
8-1073	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	H	2-0H
8-1074	4-F-Ph	2-Me0-4-Pyr	H	2-Me0
8-1075	4-F-Ph	2-Me0-4-Pyr	Н	2-Ph
8-1076	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Н	8-Me
8-1077	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Н	2-F
8-1078	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Н	2-C1
8-1079	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Н	2-Br
8-1080	4-F-Ph	2-Me04Pyr	H	2, 2-diF
8-1081	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Н	2, 2-diCl
8-1082	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Н	H
8-1083	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	H	2-OH
8-1084	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	H	2-Me0
8-1085	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	H	2-Ph
8-1086	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	H	.8-Me
8-1087	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	H	2-F
8-1088	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	H	2-C1
8-1089	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	H	2-Br
8-1090	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	H	2, 2-diF
8-1091	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Н	2,2-diCl
8-1092	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	H	H
8-1093	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	. Н	2-0H
8-1094	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	H.	2-Me0
8-1095	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	H	2-Ph
8-1096	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	H	8-Me
8-1097	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	H	2-F

8-1098	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	H	2-C1
8-1099	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Н	2-Br
8-1100	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	H	2, 2-diF
8-1101	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	H	2, 2-diCl
8-1102	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	H	Н
8-1103	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	H	2-0H
8-1104	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	H	2-Me0
8-1105	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	H	2-Ph
8-1106	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	H	8-Me
8-1107	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	H	2-F
8-1108	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	H	2-C1
8-1109	4FPh	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	H	2-Br
8-1110	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	H	2, 2-diF
8-1111	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	H	2,2-diCl
8-1112	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	H	H
8-1113	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	H	2-OH
8-1114	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	H	2-MeO
8-1115	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	H	2-Ph
8-1116	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	H	8-Me
8-1117	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	H	2-F
8-1118	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	H	2-C1··
8-1119	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	H	2-Br
8-1120	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	H	2, 2-diF
8-1121	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	H	2, 2-diCl
8-1122	4-F-Ph	4-Pym	H	H
8-1123	4-F-Ph	4-Pym	H	2-0H
8-1124	4-F-Ph	4-Pym	H .	2-MeO
8-1125	4-F-Ph	4-Pym	H	2-Ph
8-1126	4-F-Ph	4-Pym	H	8-Me
8-1127	4-F-Ph	4-Pym	H	2-F
8-1128	4-F-Ph	4-Pym	Н	2-C1
8-1129	4-F-Ph	4-Pym	H	2-Br
8-1130	4-F-Ph	4-Pym	H	2, 2-diF
8-1131	4-F-Ph	4-Pym	H	2, 2-diCl
8-1132	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	H	H
8-1133	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	H	2-0H
		•		

8-1134	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	H	2-MeO
8-1135	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	H	2-Ph
8-1136	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Н	8-Me
8-1137	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	H	2-F
8-1138	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	H	2-C1
8-1139	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	H	2-Br
8-1140	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	H	2, 2-diF
8-1141	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Н	2, 2-diCl
8-1142	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	Н	Н
8-1143	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	Н	2-0H
8-1144	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	H	2-MeO .
8-1145	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	H	2-Ph
8-1146	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	H	8-Me
8-1147	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	H	2-F
8-1148	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	Н	2-C1
8-1149	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	Н	2-Br
8-1150	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	H	2, 2-diF
8-1151	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	H	2, 2-diCl
8-1152	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	H	Н
8-1153	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	H	2-0H
8-1154	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	H	2-Me0
8-1155	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	H	2-Ph
8-1156	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	H	8-Me
8-1157	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	H	2-F
8-1158	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	H	2-C1
8-1159	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	H	2-Br
8-1160	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	H	2, 2-diF
8-1161	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	H	2, 2-diCl
8-1162	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Me	Н
8-1163	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Me	2-ОН
8-1164	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Me	2-MeO
8-1165	4-F-Ph	2-Me0-4-Pyr	Me	2-Ph
8-1166	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Me	8-Me
8-1167	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Me	2-F
8-1168	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Me	2-C1
8-1169	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Me	2-Br

8-1170	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	. Me	2, 2-diF	
8-1171	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Me		••
8-1172	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pyr	Me	Н	
8-1173	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pyr	Me	2-0H	
8-1174	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pyr	Me	2-MeO	*
8-1175	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pyr	Me		•
8-1176	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pyr	Me		
8-1177	4-F-Ph. : .	$2-NH_2-4-Pyr$	Me		1.11.4
8-1178	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pyr	Me	2-C1	
8-1179	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Me	2-Br	
8-1180	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Me		
8-1181	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Me		
8-1182	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	Н	
8-1183	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2-0H	
8-1184	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2-MeO	
8-1185	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2-Ph	
8-1186	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	8-Me	
8-1187	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2-F	
8-1188	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2-C1	
8-1189	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2-Br	
8-1190	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2, 2-d i F	100
8-1191	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2, 2-diCl	
8-1192	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	Me	H	
8-1193	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	Me	2-0H	
8-1194	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	Me	2-MeO	
8-1195	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	Me	2-Ph	
8-1196	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pyr	Me	8-Me	
8-1197	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	Me	2-F	
8-1198	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	Me	2-C1	
8-1199	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-$ 4-Pyr	Me	2-Br	
8-1200	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	Me	2, 2-diF	
8-1201	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pyr	Me	2, 2-diCl	
8-1202	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	Н	
8-1203	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2-0H-	
8-1204	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2-MeO	
8-1205	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2-Ph	

8-1206	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	8-Me
8-1207	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2-F
8-1208	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2-C1
8-1209	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2-Br
8-1210	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2, 2-diF
8-1211	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2, 2-diCl
8-1212	4-F-Ph	4-Pym	Me	H
8-1213	4-F-Ph	4-Pym	Me	2-0H
8-1214	4-F-Ph	4-Pym	Me	2-MeO
8-1215	4-F-Ph	4-Pym	Me	2-Ph
8-1216	4-F-Ph	4-Pym	Me	8-Me
8-1217	4-F-Ph	4-Pym	Me	2-F
8-1218	4-F-Ph	4-Pym	Me	2-C1
8-1219	4-F-Ph	4-Pym	Me	2-Br
8-1220	4-F-Ph	4-Pym	Me	2, 2-diF
8-1221	4-F-Ph	4-Pym	Me	2, 2-diCl
8-1222	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	Н
8-1223	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2-0H
8-1224	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2-MeO
8-1225	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2-Ph
8-1226	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	8-Me
8-1227	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2-F
8-1228	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2-C1
8-1229	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2-Br
8-1230	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2, 2-diF
8-1231	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2, 2-diCl
8-1232	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	Me	H
8-1233	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	Me	2-0H
8-1234	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	Me	2-MeO
8-1235	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	Me	2-Ph
8-1236	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	Me	8-Me ·
8-1237	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	Me	2-F
8-1238	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	Me	2-C1
8-1239	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	Me	2-Br
.8-1240	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	Me	2, 2-diF
8-1241	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	Me	2, 2-diCl

8-1242	4-F-Ph	9_DnNU_4_Drm	Ma	ΙΤ
8-1243	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym 2-BnNH-4-Pym	Me ··· Me	H
8-1244				2-0H
	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me Me	2-MeO
8-1245	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	. Me	2-Ph
8-1246	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	. Me	8-Me
8-1247	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me	2-F
8-1248	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me	2-C1
8-1249	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	· · Me	2-Br
8-1250	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me	2, 2-diF
8-1251	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me	2,2-diCl
8-1252	4-F-Ph	4-Pyr	H	2->CH <sub>2</sub>
8-1253	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2->CHMe
8-1254	4-F-Ph	4-Pyr	H	2->CHE t
8-1255	4-F-Ph	4-Pyr	H	2->CHPr
8-1256	4-F-Ph	4-Pyr	H	2->C (Me) <sub>2</sub>
8-1257	4-F-Ph	· 4-Pyr	H	2->CHPh
8-1258	4-F-Ph	4-Pyr	H	2,2-diPh
8-1259	4-F-Ph	4-Pyr	Н	$2, 2-0 (CH_2)_3 0-$
		3 -	11	2, 2 0 (On <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> 0
8-1260	4-F-Ph	4-Pyr		
				2, 2-0CH <sub>2</sub> C (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
8-1260	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-0CH <sub>2</sub> C (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0- 2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
8-1260 8-1261	4-F-Ph 4-F-Ph	4-Pyr 4-Pyr	H H	2, $2-0$ CH <sub>2</sub> C (Me) $_2$ CH <sub>2</sub> O- 2, $2-$ (CH <sub>2</sub> ) $_2-$ 2, $2-$ (CH <sub>2</sub> ) $_3-$
8-1260 8-1261 8-1262	4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr	H H	2, $2-0$ CH <sub>2</sub> C (Me) $_2$ CH <sub>2</sub> O- 2, $2-($ CH <sub>2</sub> $)_2-$ 2, $2-($ CH <sub>2</sub> $)_3-$ 2, $2-($ CH <sub>2</sub> $)_4-$
8-1260 8-1261 8-1262 8-1263	4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr	Н Н Н Н	2, $2-0$ CH <sub>2</sub> C (Me) $_2$ CH <sub>2</sub> O- 2, $2-$ (CH <sub>2</sub> ) $_2-$ 2, $2-$ (CH <sub>2</sub> ) $_3-$
8-1260 8-1261 8-1262 8-1263 8-1264	4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr	H H H H	2, $2-0$ CH <sub>2</sub> C (Me) $_2$ CH <sub>2</sub> O- 2, $2-$ (CH <sub>2</sub> ) $_2-$ 2, $2-$ (CH <sub>2</sub> ) $_3-$ 2, $2-$ (CH <sub>2</sub> ) $_4-$ 2, $2-$ (CH <sub>2</sub> ) $_5-$ 2-MeS
8-1260 8-1261 8-1262 8-1263 8-1264 8-1265	4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr	Н Н Н Н Н	2, $2-0$ CH <sub>2</sub> C (Me) $_2$ CH <sub>2</sub> O- 2, $2-($ CH <sub>2</sub> $)_2-$ 2, $2-($ CH <sub>2</sub> $)_3-$ 2, $2-($ CH <sub>2</sub> $)_4-$ 2, $2-($ CH <sub>2</sub> $)_5-$ 2-MeS 2-EtS
8-1260 8-1261 8-1262 8-1263 8-1264 8-1265 8-1266	4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr	H H H H H	2, $2-0$ CH <sub>2</sub> C (Me) $_2$ CH <sub>2</sub> O- 2, $2-$ (CH <sub>2</sub> ) $_2$ - 2, $2-$ (CH <sub>2</sub> ) $_3$ - 2, $2-$ (CH <sub>2</sub> ) $_4$ - 2, $2-$ (CH <sub>2</sub> ) $_5$ - 2-MeS 2-EtS 2-PrS
8-1260 8-1261 8-1262 8-1263 8-1264 8-1265 8-1266 8-1267	4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr 4-Pyr	H H H H H	2, $2-0CH_2C$ (Me) $_2CH_2O-$ 2, $2-(CH_2)_2-$ 2, $2-(CH_2)_3-$ 2, $2-(CH_2)_4-$ 2, $2-(CH_2)_5-$ 2-MeS 2-EtS 2-PrS 2-BuS
8-1260 8-1261 8-1262 8-1263 8-1264 8-1265 8-1266 8-1267 8-1268	4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	4-Pyr	H H H H H	2, $2-0CH_2C$ (Me) $_2CH_2O-$ 2, $2-(CH_2)_2-$ 2, $2-(CH_2)_3-$ 2, $2-(CH_2)_4-$ 2, $2-(CH_2)_5-$ 2-MeS 2-EtS 2-PrS 2-BuS 2-MeSO $_2$
8-1260 8-1261 8-1262 8-1263 8-1264 8-1265 8-1266 8-1267 8-1268 8-1269	4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph 4-F-Ph	4-Pyr	H H H H H H	2, $2-0CH_2C$ (Me) $_2CH_2O-$ 2, $2-(CH_2)_2-$ 2, $2-(CH_2)_3-$ 2, $2-(CH_2)_4-$ 2, $2-(CH_2)_5-$ 2-MeS 2-EtS 2-PrS 2-BuS 2-MeSO <sub>2</sub> 2-PhO
8-1260 8-1261 8-1262 8-1263 8-1264 8-1265 8-1266 8-1267 8-1268 8-1269 8-1270	4-F-Ph	4-Pyr	H H H H H H	2, $2-0CH_2C$ (Me) $_2CH_2O-$ 2, $2-(CH_2)_2-$ 2, $2-(CH_2)_3-$ 2, $2-(CH_2)_4-$ 2, $2-(CH_2)_5-$ 2-MeS 2-EtS 2-PrS 2-BuS 2-MeSO <sub>2</sub> 2-PhO 1-Me
8-1260 8-1261 8-1262 8-1263 8-1264 8-1265 8-1266 8-1267 8-1268 8-1269 8-1270 8-1271	4-F-Ph	4-Pyr	H H H H H H H	2, $2-0CH_2C$ (Me) $_2CH_2O-$ 2, $2-(CH_2)_2-$ 2, $2-(CH_2)_3-$ 2, $2-(CH_2)_4-$ 2, $2-(CH_2)_5-$ 2-MeS 2-EtS 2-PrS 2-BuS 2-MeSO $_2$ 2-PhO 1-Me 1-Et
8-1260 8-1261 8-1262 8-1263 8-1264 8-1265 8-1266 8-1267 8-1268 8-1270 8-1270 8-1271	4-F-Ph	4-Pyr	H H H H H H	2, $2-0CH_2C$ (Me) $_2CH_2O-$ 2, $2-(CH_2)_2-$ 2, $2-(CH_2)_3-$ 2, $2-(CH_2)_4-$ 2, $2-(CH_2)_5-$ 2-MeS 2-EtS 2-PrS 2-BuS 2-MeSO $_2$ 2-PhO 1-Me 1-Et 1-Pr
8-1260 8-1261 8-1262 8-1263 8-1264 8-1265 8-1266 8-1267 8-1268 8-1269 8-1270 8-1271 8-1272 8-1273	4-F-Ph 4-Cl-Ph 4-Cl-Ph	4-Pyr	H H H H H H H H	2, $2-0CH_2C$ (Me) $_2CH_2O-$ 2, $2-(CH_2)_2-$ 2, $2-(CH_2)_3-$ 2, $2-(CH_2)_4-$ 2, $2-(CH_2)_5-$ 2-MeS 2-EtS 2-PrS 2-BuS 2-MeSO $_2$ 2-PhO 1-Me 1-Et 1-Pr 1, 1-diMe
8-1260 8-1261 8-1262 8-1263 8-1264 8-1265 8-1266 8-1267 8-1269 8-1270 8-1271 8-1272 8-1273 8-1274	4-F-Ph 4-Cl-Ph 4-Cl-Ph 4-Cl-Ph	4-Pyr	H H H H H H H H H H H H	2, 2-0CH <sub>2</sub> C (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O- 2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> - 2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> - 2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> - 2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> - 2-MeS 2-EtS 2-PrS 2-BuS 2-MeSO <sub>2</sub> 2-PhO 1-Me 1-Et 1-Pr 1, 1-diMe 2-Me
8-1260 8-1261 8-1262 8-1263 8-1264 8-1265 8-1266 8-1267 8-1268 8-1270 8-1271 8-1272 8-1273 8-1273 8-1274	4-F-Ph 4-Cl-Ph 4-Cl-Ph 4-Cl-Ph 4-Cl-Ph	4-Pyr	H H H H H H H H	2, $2-0CH_2C$ (Me) $_2CH_2O-$ 2, $2-(CH_2)_2-$ 2, $2-(CH_2)_3-$ 2, $2-(CH_2)_4-$ 2, $2-(CH_2)_5-$ 2-MeS 2-EtS 2-PrS 2-BuS 2-MeSO $_2$ 2-PhO 1-Me 1-Et 1-Pr 1, 1-diMe

8-1278	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-Bu
8-1279	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-Allyl
8-1280	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-Ph
8-1281	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-Bn
8-1282	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-Phe t
8-1283	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2,2-diMe
8-1284	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-0H
8-1285	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-Me0
8-1286	4-Cl-Ph	4-Pyr	Н	2-E t 0
8-1287	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-Pr0
8-1288	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-di (MeO)
8-1289	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-di (EtO)
8 - 1290	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
8-1291	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-0xo
8-1292	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-F
8-1293	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-C1
8-1294	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-Br
8-1295	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-I
8-1296	4-C1-Ph	4-Pyr	. Н	2,2-diF
8-1297	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2,2-diCl
8-1298	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2,2-diBr
8-1299	4-C1-Ph	4-Pyr	H	3-Me
8-1300	4-C1-Ph	4-Pyr	H	3-E t
8-1301	4-C1-Ph	4-Pyr	H	3-Pr
8-1302	4-C1-Ph	4-Pyr	H	3,3-diMe
8-1303	4-C1-Ph	4-Pyr	H	5-Me
8-1304	4-C1-Ph	4-Pyr	H	5–E t
8-1305	4-Cl-Ph	4-Pyr	Н	5-Pr
8-1306	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	5,5-diMe
8-1307	4-Cl-Ph	4-Pyr	Н	6-Me
8-1308	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	6-Et .
8-1309	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	6-Pr
8-1310	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	6,6-diMe
8-1311	4-C1-Ph	4-Pyr	H	6-0xo
8-1312	4-C1-Ph	4-Pyr	H	8-Me
8-1313	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	8-E t

8-1314	4-Cl-Ph	4-Pyr	H 8-Pr
8-1315	4-Cl-Ph	4-Pyr	H 8-Ph
8-1316	4-Cl-Ph	4-Pyr	H 8a-Me
8-1317	4-CI-Ph	4-Pyr	H 8a-Et
8-1318	4-Cl-Ph	4-Pyr	H 8a-Pr
8-1319	4-C1-Ph	4-Pyr	. H 6,6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
8-1320	4-C1-Ph	4-Pyr	H 6,6-diF
8-1321	4-Cl-Ph	4-Pyr	2->CH <sub>2</sub>
8-1322	4-Cl-Ph	4-Pyr	H 2->CHMe
8-1323	4-C1-Ph	4-Pyr	H 2−>CHE t
8-1324	4-Cl-Ph	4-Pyr	H 2->CHPr
8-1325	4-C1-Ph	4-Pyr	$H \qquad 2-C (Me),$
8-1326	4-C1-Ph	4-Pyr	H 2->CHPh
8-1327	4-C1-Ph	4-Pyr	H 2, 2-diPh
8-1328	4-C1-Ph	4-Pyr	H 2, 2-0 (CH <sub>2</sub> ) $_30-$
8-1329	4-C1-Ph	4-Pyr	H 2, $2-0$ CH <sub>2</sub> C (Me) $_{2}$ CH <sub>2</sub> 0-
8-1330	4-C1-Ph	4-Pyr	H 2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
8-1331	4-C1-Ph	4-Pyr	H 2, $2-(CH_2)_3$
8-1332	4-Cl-Ph	4-Pyr	H 2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
8-1333	4-C1-Ph	4-Pyr	H 2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
8-1334	4-C1-Ph	4-Pyr	H 2-MeS'
8-1335	4-Cl-Ph	4-Pyr	H 2-EtS
8-1336	4-C1-Ph	4-Pyr	H 2-PrS
8-1337	4-Cl-Ph	4-Pyr	H 2-BuS
8-1338	4-C1-Ph	4-Pyr	$H = 2-MeSO_2$
8-1339	4-Cl-Ph	4-Pyr	H 2-PhO
8-1340	4-F-Ph	4-Pyr	H 2-(4-MeO-Ph)
8-1341	4-F-Ph	4-Pyr	H 2-(4-Me-Ph)
8-1342	4-F-Ph	4-Pyr	$H \qquad 2-(4-F-Ph)$
8-1343	4-F-Ph	4-Pyr	$H \qquad 2-(4-CF_8-Ph)$
8-1344	4-F-Ph	4-Pyr	H $2-(4-C1-Ph)$
8-1345	4-F-Ph	4-Pyr	$H \qquad 2-(2,4-diF-Ph)$
8-1346	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H 2-(4-MeO-Ph)
8-1347	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H 2-(4-Me-Ph)
8-1348	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H 2-(4-F-Ph)
8-1349	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H 2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
			(- VI 3 I II)

8-1350	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	H	2-(4-C1-Ph)
8-1351	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	H	2-(2, 4-diF-Ph)
8-1352	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2->CH,
8-1353	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2->CHMe
8-1354	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2->CHE t
8-1355	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2->CHPr
8-1356	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2->C (Me),
8-1357	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2->CHPh
8-1358	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-diPh
8-1359	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2, 2-0 (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> 0-
8-1360	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-0CH <sub>2</sub> C (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
8-1361	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
8-1362	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym^{-1}$	Н	$2, 2-(CH_2)_3-$
8-1363	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
8-1364	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
8-1365	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-MeS
8-1366	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-EtS
8-1367	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-PrS
8-1368	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-BuS
8-1369	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-MeSO <sub>2</sub>
8-1370	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-PhO
8-1371	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1-Me
8-1372	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1-E t
8-1373	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1-Pr
8-1374	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1,1-diMe
8-1375	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Me
8-1376	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-E t
8-1377	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2-Pr
8-1378	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Bu
8-1379	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Allyl
8-1380	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Ph
8-1381	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Bn
8-1382	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Phet
8-1383	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2,2-diMe
8-1384	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-0H
8-1385	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Me0

8-1386	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-E t O
8-1387	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Pr0
8-1388	4-Cl-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2,2-di(MeO)
8-1389	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-di (EtO)
8-1390	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
8-1391	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н.	2-0xo
8-1392	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н .	2-F
8-1393	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	: H	2-C1
8-1394	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Br
8-1395	4-CI-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-I
8-1396	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2, 2-diF
8-1397	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-diCl
8-1398	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-diBr
8-1399	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3-Me
8-1400	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	.3-E t
8-1401	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3-Pr
8-1402	4-Cl-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	3,3-diMe
8-1403	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5-Me
8-1404	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5-E t
8-1405	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5-Pr
8-1406	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н .	5,5-diMe
8-1407	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-Me
8-1408	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-E t
8-1409	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-Pr
8-1410	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	6,6-diMe
8-1411	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-0xo
8-1412	4-Cl-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	8-Me
8-1413	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	8-E t
8-1414	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Pr
8-1415	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	8-Ph
8-1416	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	8a-Me
8-1417	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8a-Et
8-1418	4-Cl-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	8a-Pr
8-1419	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
8-1420	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6,6-diF
8-1421	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2->CH <sub>2</sub>
				-

8-1422	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2->CHMe
8-1423	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2->CHE t
8-1424	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2->CHPr
8-1425	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2->C (Me) <sub>2</sub>
8-1426	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2->CHPh
8-1427	4-Cl-Ph	$2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym}$	Н	2, 2-diPh
8-1428	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	$2, 2-0 (CH_2)_30-$
8-1429	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2, 2-OCH <sub>2</sub> C (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
8-1430	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
8-1431	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -
8-1432	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
8-1433	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
8-1434	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-MeS
8-1435	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-E t S
8-1436	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-PrS
8-1437	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-BuS
8-1438	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	$2-MeSO_2$
8-1439	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Ph0
8-1440	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-MeO-Ph)
8-1441	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-Me-Ph)
8-1442	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2- (4-F-Ph)
8-1443	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	$2-(4-CF_3-Ph)$
8-1444	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-Cl-Ph)
8-1445	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(2,4-diF-Ph)
8-1446	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-MeO-Ph)
8-1447	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-Me-Ph)
8-1448	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-F-Ph)
8-1449	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	H	$2-(4-CF_3-Ph)$
8-1450	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-C1-Ph)
8-1451	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2-(2,4-diF-Ph)
8-1452	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CH <sub>2</sub>
8-1453	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHMe
8-1454	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHE t
8-1455	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHPr
8-1456	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->c (Me) <sub>2</sub>
8-1457	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHPh

8-1458	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-d i Ph	
8-1459	4-F-Ph-	4-Pyr	Me .	$2, 2-0 (CH_2)_3 0-$	٠,
8-1460	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-OCH <sub>2</sub> C (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O	-
8-1461	4-F-Ph	4-Pyr	. Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
8-1462	4-F-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-(CH_2)_3-$	
8-1463	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -	
8-1464	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	
8-1465	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-MeS	
8-1466	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-E t S	
8-1467	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-PrS	
8-1468	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-BuS	
8-1469	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-MeSO <sub>2</sub>	
8-1470	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph0	
8-1471	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	1-Me	
8-1472	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	1-Et	
8-1473	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	1-Pr	
8-1474	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	1,1-diMe	
8-1475	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Me	
8-1476	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-E t	
8-1477	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr	
8-1478	4-C1-Ph.	. 4-Pyr	· Me·	2-Bu	
8-1479	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Allyl	
8-1480	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph	
8-1481	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Bn	
8-1482	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Phet	
8-1483	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-d iMe	
8-1484	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-ОН	
8-1485	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-MeO	
8-1486	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-Et0	
8-1487	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr0	
8-1488	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (MeO)	
8-1489	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (EtO)	
8-1490	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-	
8-1491	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-0xo	
8-1492	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-F	
8-1493	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-C1	

8-1494	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me 2-Br	
8-1495	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 2-I	
8-1496	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 2,2-diF	
8-1497	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 2, 2-diCl	
8-1498	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 2,2-diBr	
8-1499	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 3-Me	
8-1500	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 3-Et	
8-1501	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 3-Pr	
8-1502	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 3,3-diMe	
8-1503	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 5-Me	
8-1504	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me 5-Et	
8-1505	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me 5-Pr	
8-1506	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 5,5-diMe	
8-1507	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 6-Me	
8-1508	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 6-Et	
8-1509	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 6-Pr	
8-1510	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 6,6-diMe	
8-1511	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 6-0xo	
8-1512	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 8-Me	
8-1513	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 8-Et	
8-1514	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 8-Pr	
8-1515	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 8-Ph	
8-1516	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 8a-Me	
8-1517	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 8a-Et	
8-1518	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 8a-Pr	
8-1519	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 6, $6-(CH_2)_2-$	
8-1520	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 6,6-diF	
8-1521	4-C1-Ph	4-Pyr	Me $2\rightarrow$ CH <sub>2</sub>	
8-1522	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 2->CHMe	
8-1523	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me 2->CHE t	
8-1524	4-C1-Ph	4-Pyr	Me 2->CHPr	
8-1525	4-C1-Ph	4-Pyr	Me $2->C$ (Me) <sub>2</sub>	
8-1526	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me 2->CHPh	
8-1527	4-Cl-Ph	. 4-Pyr	Me 2, 2-diPh	
8-1528	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me 2, 2-0 ( $CH_2$ ) $_3O-$	
8-1529	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me 2, 2-0CH <sub>2</sub> C (Me) $_2$ CH <sub>2</sub> O	_
			- 2 2	

8-1530	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-(CH_2)_2-$
8-1531	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -
8-1532	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
8-1533	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
8-1534	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-MeS
8-1535	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-EtS
8-1536	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-PrS
8-1537	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-BuS
8-1538	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	$2-MeSO_2$
8-1539	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph0
8-1540	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-MeO-Ph)
8-1541	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Me-Ph)
8-1542	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-F-Ph)
8-1543	4-F-Ph	4-Pyr	Me	$2-(4-CF_3-Ph)$
8-1544	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-C1-Ph)
8-1545	4-F-Ph	4-Pyr	М́е	2-(2, 4-diF-Ph)
8-1546	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Me0-Ph)
8-1547	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Me-Ph)
8-1548	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-F-Ph)
8-1549	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
8-1550	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-C1-Ph)
8-1551	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
8-1552	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CH <sub>2</sub>
8-1553	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHMe
8-1554	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHE t
8-1555	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHP r
8-1556	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2->C$ (Me) $_2$
8-1557	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHPh
8-1558	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-diPh
8-1559	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-0 (CH_2)_3 0-$
8-1560	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me 2	, $2-0$ CH <sub>2</sub> C (Me) $_2$ CH $_2$ O $-$
8-1561	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_2-$
8-1562	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_3-$
8-1563	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
8-1564	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_5-$
8-1565	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-MeS

8-1566	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-E t S
8-1567	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-PrS
8-1568	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-BuS
8-1569	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2-MeSO_2$
8-1570	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Ph0
8-1571	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-Me
8-1572	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-E t
8-1573	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-Pr
8-1574	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1,1-diMe
8-1575	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Me
8-1576	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-E t
8-1577	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Pr
8-1578	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Bu
8-1579	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Allyl
8-1580	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Ph
8-1581	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Bn
8-1582	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Phet
8-1583	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-diMe
8-1584	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-ОН
8-1585	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Me0
8-1586	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Et0
8-1587	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Pr0
8-1588	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-di (MeO)
8-1589	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-di (EtO)
8-1590	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-OCH,CH,O-
8-1591	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-0xo
8-1592	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-F
8-1593	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-C1
8-1594	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Br
8-1595	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-I
8-1596	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-diF
8-1597	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-diCl
8-1598	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-diBr
8-1599	4-Cl-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	3-Ме
8-1600	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	3-E t
8-1601	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	3-Pr

8-1602	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	3,3-diMe	
8-1603	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	5-Me	
8-1604	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$ .	Me	5-E t	
8-1605	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5-Pr	
8-1606	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	. Me	5,5-diMe	
8-1607	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-Me	
8-1608	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-E t	
8-1609	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	· ··∴ Me	6-Pr	
8-1610	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6,6-diMe	
8-1611	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-0xo	
8-1612	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Me	
8-1613	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-E t	
8-1614	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Pr	
8-1615	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Ph	
8-1616	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Me	
8-1617	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Et	
8-1618	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Pr	
8-1619	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	
8-1620	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6, 6-d i F	
8-1621	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CH <sub>2</sub>	
8-1622	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHMe	• •
8-1623	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHE t	
8-1624	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHPr	
8-1625	4C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2->C$ (Me) $_2$	
8-1626	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHPh	
8-1627	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-diPh	
8-1628	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-0 (CH_2)_3 0-$	
8-1629	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, $2-0$ CH <sub>2</sub> C (Me) $_{2}$ CH <sub>2</sub> 0-	
8-1630	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_2-$	
8-1631	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_3-$	
8-1632	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_4-$	
8-1633	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_5-$	
8-1634	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-MeS	
8-1635	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-EtS	
8-1636	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-PrS	
8-1637	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-BuS	

8-1638	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-MeSO,
8-1639	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Ph0
8-1640	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-MeO-Ph)
8-1641	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-Me-Ph)
8-1642	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-F-Ph)
8-1643	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
8-1644	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-C1-Ph)
8-1645	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
8-1646	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-MeO-Ph)
8-1647	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-Me-Ph)
8-1648	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2- (4-F-Ph)
8-1649	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
8-1650	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-C1-Ph)
8-1651	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
8-1652	4-C1-Ph	4-Pyr	H	Н
8-1653	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-(4-MeO-Ph)
8-1654	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2-(4-Me-Ph)
8-1656	4-Cl-Ph	4-Pyr	Н	2-(4-F-Ph)
8-1657	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	$2-(4-CF_3-Ph)$
8-1658	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-(4-C1-Ph)
8-1659	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-(2, 4-diF-Ph)
8-1660	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	H
8-1661	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-MeO-Ph)
8-1662	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Me-Ph)
8-1663	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-F-Ph)
8-1664	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
8-1665	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-C1-Ph)
8-1666	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
8-1667	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	Н
8-1668	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	H

化合物番 号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R4	<b>R⁵</b>
9-1	4-F-Ph	4-Pyr	· Me	Н
9-2	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Me
9-3	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-E t
9-4	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Pr
9-5	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1,1-diMe
9-6	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Me
9-7	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-E t
9-8	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr
9-9	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Bu
9-10	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Allyl
9-11	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph
9-12	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Bn
9-13	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Phet
9-14	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-diMe
9-15	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-0H
9-16	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Me0
9-17	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-E t 0
9-18	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr0
9-19	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (MeO)
9-20	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (EtO)
9-21	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
9-22	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-0xo
9-23	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-F
9-24	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-C1
9-25	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Br

9-26	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-I
9-27	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diF
9-28	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diC1
9-29	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diBr
9-30	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Me
9-31	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-E t
9-32	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Pr
9-33	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3,3-diMe
9-34	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Me
9-35	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-E t
9-36	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Pr
9-37	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5,5-diMe
9-38	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Me
9-39	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Et
9-40	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Pr
9-41	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-diMe
9-42	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-diF
9-43	. 4-F-Ph	4-Pyr	Me	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
9-44	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-0xo
9-45	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Me
9-46	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-E t
9-47	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Pr
9-48	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Ph
9-49 '	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Me
9-50	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Et
9-51	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Pr
9-52	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	H
9-53	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-Me
9-54	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-E t
9-55	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-Pr
9-56	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1,1-diMe
9-57	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Me
9-58	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-E t
9-59	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-Pr
9-60	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Bu
9-61	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Ally1

9-62	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Ph
9-63	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Bn
9-64	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Phet
9-65	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-2-d i Me
9-66	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-0H
9-67	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-MeO
9-68	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-E t O
9-69	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-PrO
9-70	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-di (MeO)
9-71	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-di (EtO)
9-72	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O
9-73	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-0x0
9-74	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-F
9-75	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-C1
9-76	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Br
9-77	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-I
9-78	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-diF
9-79	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-diCl
9-80	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-diBr
9-81	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	3-Me
9-82	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	3-E t
9-83	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	3-Pr
9-84	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	3,3-diMe
9-85	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5-Me
9-86	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5-E t
9-87	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5-Pr
9-88	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5,5-diMe
9-89	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-Me
9-90	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-E t
9-91	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6- <b>P</b> r
9-92	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6,6-diMe
9-93	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	. Me	6,6-diF
9-94	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$6,6-CH_2CH_2-$
9-95	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-0x0
9-96	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Me
9-97	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-E t

9-98	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Pr
9-99	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Ph
9-100	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Me
9-101	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Et
9-102	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Pr
9-103	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	. Н
9-104	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	1-Me
9-105	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	1-E t
9-106	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	1-Pr
9-107	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	1,1-diMe
9-108	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Me
9-109	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-E t
9-110	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Pr
9-111	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Bu
9-112	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Allyl
9-113	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Ph
9-114	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Bn
9-115	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Phet
9-116	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2,2-diMe
9-117	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-ОН
9-118	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-MeO
9-119	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	. Me	2-EtO
9-120	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-PrO
9-121	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2, 2-di (MeO)
9-122	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2, 2-di (Et0)
9-123	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2, 2-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
9-124	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-0xo
9-125	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-F
9-126	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-C1 -
9-127	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-Br
9-128	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2-I
9-129	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2, 2-d i F
9-130	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2, 2-diC1
9-131	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	2, 2-diBr
9-132	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	3-Me
9-133	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	3-E t

9-134	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	3-Pr .
9-135	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	3,3-diMe
9-136	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	5-Me
9-137	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	. Me	5-Et
9-138	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me .	5-Pr
9-139	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	5,5-diMe
9-140	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	6-Me
9-141	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	6-E t
9-142	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	6-Pr
9-143	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	6,6-diMe
9-144	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	6,6-diF
9-145	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> ·
9-146	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	6-0xo
9-147	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	8-Me
9-148	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	8-E t
9-149	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	8-Pr
9-150	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	8-Ph
9-151	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	8a-Me
9-152	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	8a-Et
9-153	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	Me	8a-Pr
9-154	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Me' -:	Н -
9-155	4-F-Ph	2-Me0-4-Pyr	Me	2-0H
9-156	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Me	2-MeO
9-157	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Me	2-Ph
9-158	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Me	8-Me
9-159	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Me	2-F
9-160	4-F-Ph	2-Me0-4-Pyr	Me	2-C1
9-161	4-F-Ph	2-Me0-4-Pyr	Me	2-Br
9-162	4-F-Ph	2-Me0-4-Pyr	Me	2, 2-diF
9-163	4-F-Ph	2-MeO-4-Pyr	Me	2,2-diCl
9-164	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Me	H
9-165	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Me	2-0H
9-166	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Me	2-Me0
9-167	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Me	2-Ph
9-168	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Me	8-Me
9-169	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Me	2-F

9-170	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Me	2-01
9-171	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Me	2-Br
9-172	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Me	2, 2-diF
9-173	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pyr$	Me	2,2-diC1
9-174	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	Н
9-175	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2-0H
9-176	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2-Me0
9-177	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2-Ph
9-178	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	8-Me
9-179	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2-F
9-180	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2-C1
9-181	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2-Br
9-182	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2, 2-diF
9-183	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pyr	Me	2, 2-diCl
9-184	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pyr	Me	H
9-185	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pyr	Me	2-ОН
9-186	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pyr	Me	2-Me0
9-187	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	Me	2-Ph
9-188	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	Me	8-Me
9-189	. 4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	Me	2-F
9-190	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	Me	2-C1
9-191	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	Me	2-Br
9-192	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pyr	Me	2, 2-diF
9-193	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pyr$	Me	2, 2-diCl
9-194	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	H
9-195	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2-OH
9-196	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2-MeO
9-197	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2-Ph
9-198	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	8-Me
9-199	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2-F
9-200	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2-C1
9-201	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2-Br
9-202	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2, 2-diF
9-203	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pyr	Me	2, 2-diCl
9-204	4-F-Ph	4-Pym	Me	H
9-205	4-F-Ph	4-Pym	Ме	2-0H

9-206	4-F-Ph	4-Pym	Me	2-MeO		
9-207	4-F-Ph	4-Pym	Me·	2-Ph		• .
9-208	4-F-Ph	4-Pym	Me	8-Me		
9-209	4-F-Ph	4-Pym	Me	2-F		
9-210	4-F-Ph	4-Pym	Me .	2-C1		
9-211	4-F-Ph	4-Pym	Me	2-Br		
9-212	4-F-Ph	4-Pym	Me	2, 2-d i F	• •	
9-213	4-F-Ph	4-Pym	Me .	2, 2-diCl		
9-214	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	Н		
9-215	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2-0H		
9-216	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2-MeO		
9-217	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2-Ph		
9-218	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	8-Me		
9-219	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2-F		
9-220	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2-C1		
9-221	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2-Br		
9-222	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2, 2-diF		
9-223	4-F-Ph	2-MeO-4-Pym	Me	2,2-diCl		
9-224	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	Me	H		
9-225	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	Me	2-0H		
9-226	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	Me	2-Me0		
9-227	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	Me	2-Ph		
9-228	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	Me	8-Me		
9-229	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	Me	2-F		
9-230	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	Me	2-C1		
9-231	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	Me	2-Br		
9-232	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	Me	2,2-diF		
9-233	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	Me	2, 2-diCl		
9-234	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me	H		
9-235	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me	2-0H		
9-236	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me	2-Me0	•	
9-237	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me	2-Ph		
9-238	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me	8-Me		
9-239	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me	2-F		
9-240	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me	2-C1		
9-241	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me	2-Br		

9-242	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me	2, 2-diF
9-243	4-F-Ph	2-BnNH-4-Pym	Me	
9-244	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CH,
9-245	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHMe
9-246	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHE t
9-247	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHPr
9-248	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->C(Me),
9-249	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHPh
9-250	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-diPh
9-251	4-F-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-0 (CH_2)_3 0-$
9-252	4-F-Ph	4-Pyr	Me	
9-253	4-F-Ph	4-Pyr	Me .	•
9-254	4-F-Ph	4-Pyr	Me	
9 - 255	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
9 - 256	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
9-257	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-MeS
9-258	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-EtS
9 - 259	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-PrS
9 - 260	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-BuS
9 - 261	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-MeSO <sub>2</sub>
9-262	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph0
9-263	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	1-Me
9-264	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	1-Et
9-265	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	1-Pr
9-266	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	1,1-diMe
9-267	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Me
9-268	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-E t
9-269	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr
9-270	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Bu
9 - 271	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Allyl
9-272	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph
9-273	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Bn
9-274	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Phe t
9-275	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diMe
9-276	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-0H
9-277	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Me0

9-278	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	2-E t O
9-279	4-Cl-Ph	4-Pyr	•	Me ·	2-Pr0
9-280	4-Cl-Ph	4-Pyr		Me	2, 2-di (MeO)
9-281	4-Cl-Ph	4-Pyr		Me	2, 2-di (Et0)
9-282	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C
9-283	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	2-0xo
9-284	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	2-F
9-285	4-Cl-Ph	4-Pyr		Me	2-C1
9-286	4-C1-Ph	4-Pyr	·	Me	2-Br
9-287	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	2-I
9-288	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	2, 2-diF
9-289	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	2, 2-diCl
9-290	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	2, 2-diBr
9-291	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	3-Me
9-292	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	3-E t
9-293	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	'3-Pr
9-294	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	3,3-diMe
9-295	4-Cl-Ph	4-Pyr		Me	5-Me
9-296	4-Cl-Ph	4-Pyr		Me	5-E t
9-297	4-Cl-Ph	4-Pyr		Me	5-Pr
9-298	4-C1-Ph	4-Pyr ·	: *	Me	. 5, 5-diMe
9-299	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	6-Me
9-300	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	6-E t
9-301	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	6-Pr
9-302	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	6,6-diMe .
9-303	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	6-0x0
9-304	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	8-Me
9-305	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	8-E t
9-306	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	8-Pr
9-307	4-Cl-Ph	4-Pyr		Me	8-Ph
9-308	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	8a-Me
9-309	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	8a-Et
9-310	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	8a-Pr
9-311	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	$6, 6-(CH_2)_2-$
312	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	6,6-diF
-313	4-C1-Ph	4-Pyr		Me	2->CH <sub>2</sub>

9-314	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2->CHMe
9-315	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2->CHE t
9-316	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2->CHP r
9-317	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2->C (Me) <sub>2</sub>
9-318	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2->CHPh
9-319	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-2-d i Ph
9-320	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-0 (CH_2)_30-$
9-321	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-2-0CH <sub>2</sub> C (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
9-322	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
9-323	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-(CH_2)_3-$
9-324	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-(CH_2)_4-$
9-325	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-(CH_2)_5-$
9-326	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-MeS
9-327	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-EtS
9-328	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-PrS
9-329	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-BuS
9-330	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	$2-MeSO_2$
9-331	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph0
9-332	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-MeO-Ph)
9-333	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Me-Ph)
9-334	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-F-Ph)
9-335	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
9 - 336	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Cl-Ph)
9-337	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
9-338	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-MeO-Ph)
9 - 339	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Me-Ph)
9-340	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-F-Ph)
9-341	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	$2-(4-CF_3-Ph)$
9-342	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-C1-Ph)
9-343	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
9-344	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CH <sub>2</sub>
9-345	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHMe
9-346	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHE t
9-347	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHPr
9-348	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->C (Me) <sub>2</sub>
9-349	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHPh

9-350	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2, 2-diPh
9-351	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2, 2-0 (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> 0-
9-352	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> C (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
9-353	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
9-354	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -
9-355	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -
9-356	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
9-357	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-MeS
9-358	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-EtS
9-359	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-PrS
9-360		2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-BuS
9-361	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-MeSO <sub>2</sub>
9-362	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-Ph0
9-363	4-C1-Ph		Me	1-Me
9-364	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	1-E t
9-365	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	1-Pr
9-366	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	1,1-diMe
9-367	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-Me
9-368	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-E t
9-369	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-Pr
9-370	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-Bu
9-371	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Allyl
9-372	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-Ph
9-373	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Bn
9-374	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-Phet
9-375	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-diMe
9-376	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-0H
9-377	4-Cl-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-Me0
9-378	4-Cl-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-E t O
9-379	4-Cl-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-Pr0
9-380	4-Cl-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2,2-di(MeO)
9-381	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-di (EtO)
9-382	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
9-383	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-0xo
9-384	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-F
9-385	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-C1

9-386	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Br
9-387	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-I
9-388	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-diF
9-389	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-diCl
9-390	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-diBr
9-391	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	3-Me
9-392	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	3-E t
9-393	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	3-Pr.
9-394	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	· Me	3,3-diMe
9-395	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5-Me
9-396	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me ·	5-Et
9-397	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5-Pr
9-398	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5,5-diMe
9-399	4-C1-Ph		Me	6-Ме
9-400	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-E t
9-401	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-Pr
9-402	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6,6-diMe
9-403	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-0xo
9-404	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Me
9-405	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-E t
9-406	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Pr
9-407	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Ph
9-408	4C1Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Me
9-409	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-E t
9-410	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Pr
9-411	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$6, 6-(CH_2)_2-$
9-412	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6,6-diF
9-413	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CH <sub>2</sub>
9-414	. 4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHMe
9-415	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHE t
9-416	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHPr
9-417	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2->C$ (Me) $_2$
9-418	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHPh
9-419	4-C·l-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-diPh
9-420	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-0 (CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> 0-
9-421	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> C (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-

9-422	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me.	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
9-423	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me ·	$2, 2-(CH_2)_3-$
9-424	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_4-$
9-425	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_5-$
9-426	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-MeS
9-427	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-E t S
9-428	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-PrS
9-429	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-BuS
9-430	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2-MeSO_{2}$
9-431	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Ph0
9-432	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-MeO-Ph)
9-433	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-Me-Ph)
9-434	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-F-Ph)
9-435	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
9-436	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-C1-Ph)
9-437	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
9-438	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-MeO-Ph)
9-439	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-Me-Ph)
9-440	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-F-Ph)
9-441	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
9-442	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-Cl-Ph)
9-443	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(2, 4-d iF-Ph)
9-444	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	H
9-445	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-MeO-Ph)
9-446	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Me-Ph)
9-447	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-F-Ph)
9-448	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$2-(4-CF_3-Ph)$
9-449	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Cl-Ph)
9-450	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
9-451	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	H

化合物番号	R <sup>1</sup>	R²	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
10-1	4-F-Ph	4-Pyr	Н .	1-Me
10-2	4-F-Ph	4-Pyr	H	1-E t
10-3	4-F-Ph	4-Pyr	H	1-Pr
10-4	4-F-Ph	4-Pyr	H	1,1-diMe
10-5	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Me
10-6	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-E t
10-7	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Pr
10-8	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Bu
10-9	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Ally1
10-10	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Ph
10-11	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Bn
10-12	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Phet
10-13	4-F-Ph	4-Pyr	H	2,2-diMe
10-14	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-0H
10-15 .	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-MeO
10-16	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-E t O
10-17	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Pr0
10-18	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-di (MeO)
10-19	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-di (Et0)
10-20	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
10-21	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-0xo
10-22	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-F
10-23	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-C1
10-24	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Br

10-25         4-F-Ph         4-Pyr         H         2-I           10-26         4-F-Ph         4-Pyr         H         2, 2-diF           10-27         4-F-Ph         4-Pyr         H         2, 2-diBr           10-28         4-F-Ph         4-Pyr         H         2, 2-diBr           10-29         4-F-Ph         4-Pyr         H         3-Me           10-30         4-F-Ph         4-Pyr         H         3-Bt           10-30         4-F-Ph         4-Pyr         H         3-Pr           10-31         4-F-Ph         4-Pyr         H         3-Pr           10-32         4-F-Ph         4-Pyr         H         5-Me           10-33         4-F-Ph         4-Pyr         H         5-Me           10-34         4-F-Ph         4-Pyr         H         5-Pr           10-35         4-F-Ph         4-Pyr         H         5-Pr           10-36         4-F-Ph         4-Pyr         H         6-Me           10-37         4-F-Ph         4-Pyr         H         6-Che           10-38         4-F-Ph         4-Pyr         H         6-Che           10-39         4-F-Ph         4-Pyr					
10-27       4-F-Ph       4-Pyr       H       2, 2-diCl         10-28       4-F-Ph       4-Pyr       H       2, 2-diBr         10-29       4-F-Ph       4-Pyr       H       3-Me         10-30       4-F-Ph       4-Pyr       H       3-Me         10-31       4-F-Ph       4-Pyr       H       3-Pr         10-31       4-F-Ph       4-Pyr       H       3-Pr         10-32       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Me         10-33       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Me         10-34       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Et         10-35       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Pr         10-36       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Pr         10-36       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Me         10-37       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Et         10-38       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Ct         10-39       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-41       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H	10-25	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-I
10-28       4-F-Ph       4-Pyr       H       2, 2-diBr         10-29       4-F-Ph       4-Pyr       H       3-Me         10-30       4-F-Ph       4-Pyr       H       3-Et         10-31       4-F-Ph       4-Pyr       H       3-Pr         10-32       4-F-Ph       4-Pyr       H       3, 3-diMe         10-33       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Me         10-34       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Et         10-35       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Pr         10-36       4-F-Ph       4-Pyr       H       5,5-diMe         10-37       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Me         10-38       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Et         10-39       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Che         10-40       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-41       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-Ch2cH         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       8-B-Bt         10-44       4-F-Ph       4-Pyr       H	10-26	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-diF
10-29       4-F-Ph       4-Pyr       H       3-Me         10-30       4-F-Ph       4-Pyr       H       3-Et         10-31       4-F-Ph       4-Pyr       H       3-Pr         10-32       4-F-Ph       4-Pyr       H       3,3-diMe         10-33       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Me         10-34       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Et         10-34       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Et         10-35       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Pr         10-36       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Me         10-37       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Me         10-38       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Et         10-39       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Et         10-39       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-40       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-41       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-44       4-F-Ph       4-Pyr       H	10-27	4-F-Ph	4-Pyr	H	2,2-diCl
10-30       4-F-Ph       4-Pyr       H       3-Et         10-31       4-F-Ph       4-Pyr       H       3-Pr         10-32       4-F-Ph       4-Pyr       H       3, 3-diMe         10-33       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Me         10-34       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Et         10-35       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Pr         10-36       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-FdiMe         10-36       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Me         10-37       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Me         10-38       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Et         10-39       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Challe         10-39       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-G-diMe         10-40       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-G-diMe         10-41       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-G-diMe         10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-G-CH2CH         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Bt         10-44       4-F-Ph       4-Pyr       H	10-28	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-diBr
10-31	10-29	4-F-Ph	4-Pyr	H	3-Me
10-32       4-F-Ph       4-Pyr       H       3, 3-diMe         10-33       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Me         10-34       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Et         10-35       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Pr         10-36       4-F-Ph       4-Pyr       H       5,5-diMe         10-37       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Me         10-38       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Et         10-39       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Et         10-39       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-40       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-41       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diF         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-CH2CH         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Me         10-45       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Et         10-46       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Et         10-47       4-F-Ph       4-Pyr <td< td=""><td>10-30</td><td>4-F-Ph</td><td>4-Pyr</td><td>Н</td><td>3-E t</td></td<>	10-30	4-F-Ph	4-Pyr	Н	3-E t
10-33	10-31	4-F-Ph	4-Pyr	Н	3-Pr
10-34       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Et         10-35       4-F-Ph       4-Pyr       H       5-Pr         10-36       4-F-Ph       4-Pyr       H       5,5-diMe         10-37       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Me         10-38       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Me         10-39       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Et         10-39       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Ct         10-40       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-40       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-41       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diF         10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-CH2CH         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Me         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Me         10-44       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Pt         10-45       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Pt         10-46       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pt         10-48       4-F-Ph       4-Pyr       Me <td>10-32</td> <td>4-F-Ph</td> <td>4-Pyr</td> <td>H</td> <td>3,3-diMe</td>	10-32	4-F-Ph	4-Pyr	H	3,3-diMe
10-35	10-33	4-F-Ph	4-Pyr	H	5-Me
10-36       4-F-Ph       4-Pyr       H       5,5-diMe         10-37       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Me         10-38       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Et         10-39       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Pr         10-40       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-40       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-41       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-41       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-CH2CH2CH         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-CH2CH2CH         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Me         10-44       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Me         10-45       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Et         10-45       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Me         10-47       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pr         10-48       4-F-Ph       4-Pyr </td <td>10-34</td> <td>4-F-Ph</td> <td>4-Pyr</td> <td>H</td> <td>5-E t</td>	10-34	4-F-Ph	4-Pyr	H	5-E t
10-37       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Me         10-38       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Et         10-39       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Pr         10-40       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-40       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-41       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diF         10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diF         10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-CH2CH         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-CH2CH         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Me         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Me         10-44       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Et         10-45       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Me         10-46       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Et         10-47       4-F-Ph       4-Pyr	10-35	4-F-Ph	4-Pyr	H	5-Pr
10-38       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Et         10-39       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Pr         10-40       4-F-Ph       4-Pyr       H       6, 6-diMe         10-41       4-F-Ph       4-Pyr       H       6, 6-diMe         10-41       4-F-Ph       4-Pyr       H       6, 6-diMe         10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H       6, 6-CH <sub>2</sub> CH         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Me         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Me         10-44       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Et         10-45       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Et         10-45       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Et         10-45       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Me         10-46       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Me         10-47       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Et         10-48       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Et         10-49       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-IndiMe         10-50       4-F-Ph       4-Pyr	10-36	4-F-Ph	4-Pyr	H	5,5-diMe
10-39	10-37	4-F-Ph	4-Pyr	H	6-Me
10-40       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diMe         10-41       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-diF         10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-CH2CH         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-Oxo         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Me         10-44       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Me         10-45       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Et         10-45       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Pr         10-46       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Me         10-47       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Me         10-48       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Et         10-49       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pr         10-50       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pr         10-50       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Me         10-51       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Et         10-52       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Pt         10-53       4-F-Ph       4-Pyr       Me <td>10-38</td> <td>4-F-Ph</td> <td>4-Pyr</td> <td>H</td> <td>6-E t</td>	10-38	4-F-Ph	4-Pyr	H	6-E t
10-41	10-39	4-F-Ph	4-Pyr	Н	6-Pr
10-42       4-F-Ph       4-Pyr       H       6,6-CH2CH         10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-0xo         10-44       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Me         10-45       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Et         10-45       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Et         10-46       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Pr         10-47       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Me         10-48       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Et         10-48       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Et         10-49       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pr         10-50       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Inde         10-50       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Inde         10-51       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Me         10-52       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Pt         10-53       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Pt         10-54       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-55       4-F-Ph       4-Pyr       Me </td <td>10-40</td> <td>4-F-Ph</td> <td>4-Pyr</td> <td>H</td> <td>6,6-diMe</td>	10-40	4-F-Ph	4-Pyr	H	6,6-diMe
10-43       4-F-Ph       4-Pyr       H       6-0xo         10-44       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Me         10-45       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Et         10-46       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Pr         10-47       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Me         10-47       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Et         10-48       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pr         10-48       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pr         10-49       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pr         10-50       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1, 1-diMe         10-50       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Me         10-51       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Et         10-52       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Pr         10-53       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-55       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Ph         10-56       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Ph         10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me	10-41	4-F-Ph	4-Pyr	H	6,6-diF
10-44       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Me         10-45       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Et         10-46       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Pr         10-47       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Me         10-47       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Et         10-48       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pr         10-49       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pr         10-50       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-I-diMe         10-50       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Me         10-51       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Et         10-52       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Pr         10-53       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-54       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-55       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Ph         10-56       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bn         10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-59       4-F-Ph       4-Pyr       Me<	10-42	4-F-Ph	4-Pyr	H	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
10-45       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Et         10-46       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Pr         10-47       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Me         10-48       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Et         10-49       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pr         10-50       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1, 1-diMe         10-51       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Me         10-52       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Et         10-53       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Pr         10-53       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-55       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-56       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bn         10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-58       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-59       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2, 2-diMe	10-43	4-F-Ph	4-Pyr	H	6-0x0
10-46       4-F-Ph       4-Pyr       H       8a-Pr         10-47       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Me         10-48       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Et         10-49       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pr         10-50       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1, 1-diMe         10-51       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Me         10-52       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Et         10-53       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Pr         10-54       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bu         10-55       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-56       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bn         10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-58       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-59       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2, 2-diMe	10-44	4- <b>F</b> -Ph	4-Pyr	H	8a-Me
10-47       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Me         10-48       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Et         10-49       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pr         10-50       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1, 1-diMe         10-51       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Me         10-52       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Et         10-53       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Pr         10-54       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bu         10-55       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-56       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Ph         10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-58       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-59       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2, 2-diMe	10-45	4-F-Ph	4-Pyr	H	8a-Et
10-48       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Et         10-49       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pr         10-50       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1, 1-diMe         10-51       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Me         10-52       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Et         10-53       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Pr         10-54       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bu         10-55       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-56       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Ph         10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bn         10-58       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-59       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2, 2-diMe	10-46	, 4-F-Ph	4-Pyr	H	. 8a-Pr
10-49       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1-Pr         10-50       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1, 1-diMe         10-51       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Me         10-52       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Et         10-53       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Pr         10-54       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bu         10-55       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-56       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Ph         10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bn         10-58       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-59       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2, 2-diMe	10-47	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Me
10-50       4-F-Ph       4-Pyr       Me       1, 1-diMe         10-51       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Me         10-52       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Et         10-53       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Pr         10-54       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bu         10-55       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-56       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Ph         10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bn         10-58       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-59       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2, 2-diMe	10-48	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-E t
10-51       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Me         10-52       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Et         10-53       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Pr         10-54       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bu         10-55       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-56       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Ph         10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bn         10-58       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-59       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2, 2-diMe	10-49	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Pr
10-52       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Et         10-53       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Pr         10-54       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bu         10-55       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-56       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Ph         10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bn         10-58       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-59       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2, 2-diMe	10-50	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1,1-diMe
10-53       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Pr         10-54       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bu         10-55       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-56       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Ph         10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bn         10-58       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-59       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2, 2-diMe	10-51	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Me
10-54       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bu         10-55       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-56       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Ph         10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bn         10-58       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-59       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2, 2-diMe	10-52	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-E t
10-55       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Allyl         10-56       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Ph         10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bn         10-58       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-59       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2, 2-diMe	10-53	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2- <b>P</b> r
10-56       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Ph         10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bn         10-58       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-59       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2, 2-diMe	10-54	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Bu
10-57       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Bn         10-58       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2-Phet         10-59       4-F-Ph       4-Pyr       Me       2, 2-diMe	10-55	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-A11y1
10-58	10-56	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph
10-59 4-F-Ph 4-Pyr Me 2, 2-diMe	10-57	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Bn
10-59 4-F-Ph 4-Pyr Me 2, 2-diMe		4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Phet
10-60 4-F-Ph 4-Pyr Me 2-OH		4-F-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diMe
	10-60	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-0H

10-61	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-MeO
10-62	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-E t O
10-63	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr0
10-64	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (MeO)
10-65	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (Et0)
10-66	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
10-67	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-0xo
10-68	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-F
10-69	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-C1
10-70	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Br
10-71	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-1
10-72	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-d i F
10-73	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-diCl
10-74	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-d i Br
10-75	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Me
10-76	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-E t
10-77	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Pr
10-78	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3,3-diMe
10-79	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Me
10-80	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-E t
10-81	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Pr
10-82	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5,5-diMe
10-83	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Me
10-84	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-E t
10-85	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-P r
10-86	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-diMe
10-87	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-diF
10-88	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
10-89	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-0xo
10-90	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Me
10-91	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-E t
10-92	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Pr

化合物番号	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
11-1	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Me .
11-2	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Et
11-3	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Pr
11-4	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1,1-diMe
11-5	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Me
11-6	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-E t
11-7	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr
11-8	4-F-Ph	4-Pyr	. Me	2-Bu
11-9	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Ally1
11-10	4-F-Ph	4-Pyr	Me '	2-Ph ``
11-11	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Bn
11-12	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Phet
11-13	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-diMe
11-14	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-0H
11-15	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-MeO
11-16	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-E t O
11-17	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr0
11-18	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (MeO)
11-19	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (EtO)
11-20	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
11-21	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-0xo
11-22	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-F
11-23	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-C1
11-24	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Br
11-25	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-I

11-26	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-diF
11-27	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-diCl
11-28	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-diBr
11-29	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Me
11-30	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-E t
11-31	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Pr
11-32	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3,3-diMe
11-33	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Me
11-34	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-E t
11-35	4-F-Ph .	4-Pyr	Me	5-Pr
11-36	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5, 5-diMe
11-37	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Me
11-38	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-E t
11-39	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Pr
11-40	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-diMe
11-41	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-diF
11-42	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
11-43	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-0xo
11-44	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Me
11-45	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Et
11-46	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Pr

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
12-1	4-F-Ph	4-Pyr	Н	1-Me

12-2	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2-Me
12-3	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2-E t
12-4	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Pr
12-5	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2-Bu
12-6	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Allyl
12-7	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Ph
12-8	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2-Bn
12-9	4-F-Ph	4-Pyr ·	H	2-Phe t
12-10	4-F-Ph	4-Pyr	H	3-Me
12-11	4-F-Ph.	4-Pyr	H	3-E t
12-12	4-F-Ph	4-Pyr	H	3-Pr
12-13	4-F-Ph	4-Pyr	H	3,3-diMe
12-14	4-F-Ph	4-Pyr	H	5-Me
12-15	4-F-Ph	4-Pyr	H	5-E t
12-16	4-F-Ph	4-Pyr	H	5-Pr
12-17	4-F-Ph	4-Pyr	H	5,5-diMe
12-18	4-F-Ph	4-Pyr	H	6-Me
12-19	4-F-Ph	4-Pyr	H	6-E t
12-20	4-F-Ph	4-Pyr	H	6-Pr
12-21	4-F-Ph	4-Pyr	H	6,6-diMe
12-22	4-F-Ph	4-Pyr·	- H	6,6-diF
12-23	4-F-Ph	4-Pyr	Н	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
12-24	4-F-Ph	4-Pyr	H	6-0xo
12-25	4-F-Ph	4-Pyr	H	8-Me
12-26	4-F-Ph	4-Pyr	H	8-E t
12-27	4-F-Ph	4-Pyr	H	8-Pr
12-28	4-F-Ph	4-Pyr	H	8-Ph
12-29	4-F-Ph	4-Pyr	H	8a-Me
12 - 30	4-F-Ph	4-Pyr	H	8a-Et
12-31	4-F-Ph	4-Pyr	H	8a-Pr
12-32	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Me
12-33	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Me
12-34	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-E t
12-35	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr
12-36	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Bu
12-37	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Allyl

12-38	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph
12-39	4-F-Ph	4-Pyr	Мę	2-Bn
12-40	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Phet
12-41	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Me
12-42	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-E t
12-43	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Pr
12-44	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3,3-diMe
12-45	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Me
12-46	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-E t
12-47	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Pr
12-48	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5,5-diMe
12-49	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Ме
12-50	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-E t
12-51	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Pr
12-52	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-diMe
12-53	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-diF
12-54	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6, 6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
12-55	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-0xo
12-56	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Me
12-57	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-E t
12-58	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Pr
12-59	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Ph
12-60	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Me
12-61	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Et
12-62	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Pr
12-63	4-F-Ph	4-Pyr	H	H

化合物	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	$\mathbb{R}^5$	
番 号		-			
13-1	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Me	
13-2	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Me	·
13-3	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-E t	
13-4	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr	
13-5	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Bu	
13-6	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Ally1	•
13-7	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph	
13-8	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Bn	
13-9	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Phe t	
13-10	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Me	
13-11	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-E t	
13-12	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Pr	
13-13	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3,3-diMe	
13-14	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Me	
13-15	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-E t	
13-16	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Pr	
13-17	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5,5-diMe	
13-18	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Me	
13-19	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-E t	
13-20	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Pr	
13-21	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-diMe	
13-22	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-diF	
13-23	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6,6-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	
13-24	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-0xo	
13-25	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Me	
13-26	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-E t	
13-27	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8- <b>P</b> r	
13-28	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Ph	
13-29	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Me	
13-30	4-F-Ph	4-Pyr	Me ·	8a-Et	
13-31	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Pr	
13-32	4-F-Ph	4-Pyr	Me	Н	

表 14

化合物番 号	R <sup>1</sup>	R²	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
14-1	4-F-Ph	4-Pyr	Н	Н
14-2	4-F-Ph	4-Pyr	H	1-Me
14-3	4-F-Ph	4-Pyr	H	1-E t
14-4	4-F-Ph	4-Pyr	H	1-Pr
14-5	4-F-Ph	4-Pyr	H	1,1-diMe
14-6	4-F-Ph.	4-Pyr	H	2-Me
14-7	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-E t
14-8	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Pr
14-9	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Bu
14-10	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Ally1
14-11	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Ph
14-12	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Bn
14-13	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Phet
14-14	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-diMe
14-15	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-0H
14-16	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-MeO
14-17	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-EtO
14-18	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-PrO
14-19	4-F-Ph	4-Pyr	H	2,2-di (MeO)
14-20	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-di (EtO)
14-21	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
14-22	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-0xo

WO 03/015781 PCT/JP02/08276

179

14-23	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-F
14-24	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-C1
14-25	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Br
14-26	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-I
14-27	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-diF
14-28	4-F-Ph	4-Pyr	Н	2,2-diCl
14-29	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-diBr
14-30	4-F-Ph	4-Pyr	Н.	3-Me
14-31	4-F-Ph	4-Pyr	H	3-E t
14-32	4-F-Ph	4-Pyr	H	3-Pr
14-33	4-F-Ph	4-Pyr	H	3,3-diMe
14-34	4-F-Ph	4-Pyr	H	5-Me
14-35	4-F-Ph	4-Pyr	H	5-E t
14-36	4-F-Ph	4-Pyr	Н	5-Pr
14-37	4-F-Ph	4-Pyr	H	5,5-diMe
14-38	4-F-Ph	4-Pyr	H	6-Me
14-39	4-F-Ph	4-Pyr	H	6-E t
14-40	4-F-Ph	4-Pyr	H	6-Pr
14-41	4-F-Ph	4-Pyr	H	6-Ph
14-42	4-F-Ph	4-Pyr	H	8-Me
14-43	4-F-Ph	4-Pyr	. Н	8-E t
14-44	4-F-Ph	4-Pyr	H	8-Pr
14-45	4-F-Ph	4-Pyr	H	8,8-diMe
14-46	4-F-Ph	4-Pyr	H	8,8-diF
14-47	4-F-Ph	4-Pyr	H	8,8-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
14-48	4-F-Ph	4-Pyr	H	8-0xo
14-49	4-F-Ph	4-Pyr	H	8a-Me
14-50	4-F-Ph	4-Pyr	H ·	8a-Et
14-51	4-F-Ph	4-Pyr	H	8a-Pr
14-52	4-F-Ph	, 4-Pyr	Me	H
14-53	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Me
14-54	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-E t
14-55	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Pr
14-56	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1,1-diMe
14-57	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Me
14-58	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-E t

14-59	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr
14-60	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Bu
14-61	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Allyl
14-62	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph
14-63	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Bn
14-64	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Phet
14-65	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diMe
14-66	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-0H
14-67	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-MeO
14-68	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-E t O
14-69	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr0
14-70	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2,2-di(MeO)
14-71	-4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (Et0)
14-72	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
14-73	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-0xo
14-74	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-F
14-75	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-C1
14-76	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Br
14-77	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-I
14-78	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diF
14-79	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diCl
14-80	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-diBr
14-81	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Me
14-82	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-E t
14-83	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-P r
14-84	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3,3-diMe
14-85	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Me
14-86	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-E t
14-87	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Pr
14-88	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5,5-diMe
14-89	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Me
14-90	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-E t
14-91	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Pr
14-92	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Ph
14-93	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Me
14-94	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-E t

14-95	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Pr
14-96	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8,8-diMe
14-97	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8, 8-d i F
14-98	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8, 8-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
14-99	4-F-Ph	4-Pyr -	Me	8-0xo
14-100	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Me
14-101	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Et
14-102	4-F-Ph	4-Pyr	Me .	8a-Pr
14-103	4-F-Ph	4-Pyr	H	2->CH <sub>2</sub>
14-104	4-F-Ph	4-Pyr	H	2->CHMe
14-105	4-F-Ph	4-Pyr	H	2->CHE t
14-106	4-F-Ph	4-Pyr	H	2->CHP r
14-107	4-F-Ph	4-Pyr	H	$2->C (Me)_2$
14-108	4-F-Ph	4-Pyr	H	2->CHPh
14-109	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-d i Ph
14-110	4-F-Ph	4-Pyr	H	$2, 2-0 (CH_2)_30-$
14-111	4-F-Ph	4-Pyr	H	$2, 2-0$ CH <sub>2</sub> C (Me) $_{2}$ CH <sub>2</sub> O-
14-112	4-F-Ph	4-Pyr	H	$2, 2-(CH_2)_2-$
14-113	4-F-Ph	4-Pyr	H	$2, 2-(CH_2)_3-$
14-114	4-F-Ph	4-Pyr	H	$2, 2-(CH_2)_4-$
14-115	4-F-Ph	4-Pyr	H	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
14-116	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-MeS
14-117	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-EtS
14-118	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-PrS
14-119	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-BuS
14-120	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-MeSO <sub>2</sub>
14-121	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-Ph0
14 - 122	4-C1-Ph	4-Pyr	H	1-Me
14-123	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	1-Et
14-124	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	1-Pr
14-125	4-C1-Ph	4-Pyr	H	1,1-diMe
14-126	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2-Me
14-127	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-E t
14-128	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-Pr
14-129	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-Bu
14-130	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-A11y1

14-131	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-Ph
14-132	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-Bn
14-133	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-Phet
14-134	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2,2-diMe
14-135	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2-0H
14-136	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-Me0
14-137	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-E t O
14-138	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-Pr0
14-139	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2,2-di(MeO)
14-140	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2, 2-di (EtO)
14-141	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
14-142	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-0xo
14-143	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-F
14-144	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-C1
14-145	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-Br
14-146	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-I
14-147	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2, 2-diF
14-148	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2, 2-diCl
14-149	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2, 2-diBr
14-150	4-C1-Ph	4-Pyr	H	3-Me
14-151	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	3-E t
14-152	4-C1-Ph	4-Pyr	H	3-Pr
14-153	4-C1-Ph	4-Pyr	Н	3,3-diMe
14-154	4-C1-Ph	4-Pyr	H	5-Me
14-155	4-C1-Ph	4-Pyr	H	5-E t
14-156	4-C1-Ph	4-Pyr	H	5-Pr
14-157	4-C1-Ph	4-Pyr	H	5,5-diMe
14-158	4-C1-Ph	4-Pyr	H	6-Me
14-159	4-C1-Ph	4-Pyr	H	6-E t
14-160	4-C1-Ph	4-Pyr	H	6-Pr
14-161	4-C1-Ph	4-Pyr	H	6,6-diMe
14-162	4-C1-Ph	4-Pyr	H	6-0xo
14-163	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	8-Me
14-164	4-C1-Ph	4-Pyr	H	8-E t
14-165	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	8-Pr
14-166	4-C1-Ph	4-Pyr	H	8-Ph

14-167	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	8a-Me
14-168	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	8a-Et
14-169	4-C1-Ph	4-Pyr	H	8a-Pr
14-170	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	6, 6-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
14-171	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	6,6-diF
14-172	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2->CH <sub>2</sub>
14-173	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2->CHMe
14-174	4-C1-Ph	4-Pyr	Н :	2->CHE t
14-175	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2->CHP r
14-176	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	$2->C (Me)_2$
14-177	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2->CHPh
14-178	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2, 2-diPh
14-179	4-C1-Ph	4-Pyr	H	$2, 2-0 (CH_2)_30-$
14-180	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2, 2-OCH2C (Me) 2CH2O-
14-181	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
14-182	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	$2, 2-(CH_2)_3-$
14-183	4-C1-Ph	4-Pyr	H	$2, 2-(CH_2)_4-$
14-184	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -
14-185	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2-MeS
14-186	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2-EtS
14-187	4-Cl-Ph	4-Pyr 🚟 🖰	H	2-PrS······
14-188	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2-BuS
14-189	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-MeSO <sub>2</sub>
14-190	4-Cl-Ph	4-Pyr	H .	2-Ph0
14-191	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-(4-MeO-Ph)
14-192	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-(4-Me-Ph)
14-193	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-(4-F-Ph)
14-194	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
14-195	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-(4-C1-Ph)
14-196	4-F-Ph	4-Pyr	H	2-(2, 4-diF-Ph)
14-197	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-(4-MeO-Ph)
14-198	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-(4-Me-Ph)
14-199	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-(4-F-Ph)
14-200	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
14-201	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	H	2-(4-C1-Ph)
14-202	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	H	2-(2, 4-diF-Ph)

14-203	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2->CH <sub>2</sub>
14-204	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2->CHMe
14-205	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2->CHE t
14-206	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2->CHP r
14-207	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2->C (Me) <sub>2</sub>
14-208	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2->CHPh
14-209	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-diPh
14-210	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	$2, 2-0 (CH_2)_3 0-$
14-211	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, $2-0$ CH $_2$ C (Me) $_2$ CH $_2$ O-
14-212	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	$2, 2-(CH_2)_2-$
14-213	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	$2, 2-(CH_2)_3-$
14-214	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	$2, 2-(CH_2)_4-$
14-215	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	$2, 2-(CH_2)_5-$
14-216	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-MeS
14-217	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-EtS
14-218	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-PrS
14-219	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-BuS
14-220	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-MeSO <sub>2</sub>
14-221	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Ph0
14-222	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1-Me
14-223	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1-Et
14-224	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1-Pr
14-225	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	1,1-diMe
14-226	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Me
14-227	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2–E t
14-228	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Pr
14-229	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Bu
14-230	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Allyl
14-231	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Ph
14-232	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Bn
14-233	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Phet
14-234	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2,2-diMe
14-235	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-ОН
14-236	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Me0
14-237	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Et0
14-238	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Pr0

14-239	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Н	2,2-di(MeO)
14-240	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-di (EtO)
14-241	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
14-242	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н.	2-0xo
14-243	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-F
14-244	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-C1
14-245	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Br
14-246	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-I
14-247	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2,2-diF
14-248	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2,2-diCl
14-249	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2,2-diBr
14-250	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н	3-Me
14-251	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3-E t
14-252	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3-P r
14-253	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	3,3-diMe
14-254	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5-Me
14-255	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5-E t
14-256	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5-Pr
14-257	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	5,5-diMe
14-258	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-Me
14-259	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	. Н	6-E t
14-260	4-C1-Ph	$2-NH_z-4-Pym$	H	6-Pr
14-261	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Н.	6,6-diMe
14-262	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	6-0xo
14-263	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Me
14-264	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-E t
14-265	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Pr
14-266	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8-Ph
14-267	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8a-Me
14-268	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8a-Et
14-269	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	8a-Pr
14-270	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	$6, 6-(CH_2)_2-$
14-271	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	6,6-diF
14-272	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2->CH <sub>2</sub>
14-273	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2->CHMe
14-274	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2->CHE t

14-275	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2->CHP r
14-276	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2->C(Me),
14-277	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2->CHPh
14-278	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2, 2-diPh
14-279	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	$2, 2-0 (CH_2)_30-$
14-280	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	H	2, 2-0CH <sub>2</sub> C (Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
14-281	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
14-282	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -
14-283	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	$2, 2-(CH_2)_4-$
14-284	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	$2, 2-(CH_2)_5-$
14-285	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-MeS
14-286	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-E t S
14-287	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-PrS
14-288	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-BuS
14-289	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	$2-MeSO_2$
14-290	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-Ph0
14-291	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-MeO-Ph)
14-292	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-Me-Ph)
14-293	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-F-Ph)
14-294	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
14-295	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-C1-Ph)
14-296	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(2, 4-diF-Ph)
14-297	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-MeO-Ph)
14-298	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-Me-Ph)
14-299	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-F-Ph)
14-300	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	$2-(4-CF_3-Ph)$
14-301	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(4-Cl-Ph)
14-302	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	2-(2, 4-diF-Ph)
14-303	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CH <sub>2</sub>
14-304	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHMe
14-305	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHE t
14-306	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHPr
14-307	4-F-Ph	4-Pyr	Me	$2->C (Me)_2$
14-308	4-F-Ph	4-Pyr	Ме	2->CHPh
14-309	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-diPh
14-310	4-F-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-0 (CH_2)_3 0-$

14-311	4-F-Ph	4-Pyr	Me		$2, 2-0$ CH $_2$ C (Me) $_2$ CH $_2$ 0-
14-312	4-F-Ph	4-Pyr	Me		$2, 2-(CH_2)_2-$
14-313	4-F-Ph	4-Pyr	Me		$2, 2-(CH_2)_3-$
14-314	4-F-Ph	4-Pyr	Me		$2, 2-(CH_2)_4-$
14-315	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1	$2, 2-(CH_2)_5-$
14-316	4-F-Ph	4-Pyr	Me		2-MeS
14-317	4-F-Ph	4-Pyr	Me		2-EtS
14-318	4-F-Ph	4-Pyr	Me		2-PrS
14-319	4-F-Ph	4-Pyr	Me		2-BuS
14-320	4-F-Ph	4-Pyr	Me		$2-MeSO_{z}$
14-321	4-F-Ph	4-Pyr	Me		2-Ph0
14-322	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me		1-Me
14-323	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		1-Et .
14-324	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		1-Pr
14-325	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		1,1-diMe
14-326	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		2-Me
14-327	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	٠,	2–E t
14-328	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		2-P r
14-329	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		2–Bu
14-330	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		2-Allyl
14-331	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	٠.	2-Ph :
14-332	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me		2-Bn
14-333	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		2-Phe t
14-334	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		2, 2-diMe
14-335	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		2-0H
14-336	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me		2-Me0
14-337	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		2-Et0
14-338	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me		2-Pr0
14-339	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		2, 2-di (MeO)
14-340	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		2, 2-di (Et0)
14-341	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
14-342	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me		2-0xo
14-343	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me		2-F
14-344	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		2-C1
14-345	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me		2-Br
14-346	4-C1-Ph	4-Pyr	Me		2-I

14-347	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diF
14-348	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-diCl
14-349	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-diBr
14-350	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	3-Me
14-351	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	3-E t
14-352	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	3-Pr
14-353	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	3,3-diMe
14-354	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	5-Me
14-355	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	5-E t
14-356	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	5-Pr
14-357	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	5,5-diMe
14-358	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	6-Me
14-359	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	6-Et
14-360	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	6-Pr
14-361	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	6,6-diMe
14-362	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	6-0xo
14-363	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	8-Me
14-364	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	8-E t
14-365	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	8-Pr
14-366	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	8-Ph
14-367	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	8a-Me
14-368	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	8a-Et
14-369	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	8a-Pr
14-370	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$6, 6-(CH_2)_2-$
14-371	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	6,6-diF
14-372	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2->CH <sub>2</sub>
14-373	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2->CHMe
14-374	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2->CHE t
14-375	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2->CHP r
14-376	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$2->C$ (Me) $_2$
14-377	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2->CHPh
14-378	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diPh
14-379	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-0 (CH_2)_3 0-$
14-380	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$\cdot$ 2, 2-OCH <sub>2</sub> C (Me) $_2$ CH $_2$ O-
14-381	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
14-382	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-(CH_2)_3-$

14-383	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-(CH_2)_4-$
14-384	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-(CH_2)_5-$
14-385	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-MeS
14-386	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-EtS
14-387	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-PrS
14-388	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-BuS
14-389	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$2-MeSO_2$
14-390	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-PhO
14-391	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-MeO-Ph)
14-392	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Me-Ph)
14-393	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-F-Ph)
14-394	4-F-Ph	4-Pyr	Me	$2-(4-CF_3-Ph)$
14-395	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-C1-Ph)
14-396	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
14-397	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-MeO-Ph)
14-398	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Me-Ph)
14-399	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-F-Ph)
14-400	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
14-401	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Cl-Ph)
14-402	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
14-403	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CH <sub>2</sub>
14-404	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHMe
14-405	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHE t
14-406	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHPr
14-407	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2->C$ (Me) $_2$
14-408	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2−>CHPh
14-409	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-diPh
14-410	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-0 (CH_2)_3 0-$
14-411	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-0$ CH <sub>2</sub> C (Me) $_{2}$ CH <sub>2</sub> 0-
14-412	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_2-$
14-413	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_3-$
14-414	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_4-$
14-415	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_5-$
14-416	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-MeS
14-417	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-EtS
14-418	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-PrS

11 110	4 D D1	0 1777 4 75		
14-419	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-BuS
14-420	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	$2-MeSO_2$
14-421	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-Ph0
14-422	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-Me
14-423	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-E t
14-424	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-Pr
14-425	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1,1-diMe
14-426	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Me
14-427	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me.	2–E t
14-428	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Pr
14-429	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Bu
14-430	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Allyl
14-431	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Ph
14-432	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Bn
14-433	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Phet
14-434	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-diMe
14-435	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-0H
14-436	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-MeO
14-437	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-E t O
14-438	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Pr0
14-439	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-di(MeO)
14-440	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-di (EtO)
14-441	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-
14-442	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-0xo
14-443	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-F
14-444	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-C1
14-445	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Br
14-446	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-I
14-447	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-diF
14-448	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-diCl
14-449	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-diBr
14-450	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me.	3-Me
14-451	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	3-E t
14-452	4-Cl-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	3-Pr
14-453	4-Cl-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	3, 3-diMe
14-454	4-C1-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	5-Me

14-455	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5-E t
14-456	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5-Pr
14-457	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5,5-diMe
14-458	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-Me
14-459	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-Et .
14-460	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-Pr
14-461	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6,6-diMe
14-462	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$ .	Me	6-0xo ·
14-463	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Me
14-464	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Et
14-465	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Pr
14-466	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Ph
14-467	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Me
14-468	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Et
14-469	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Pr
14-470	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$6, 6-(CH_2)_2-$
14-471	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6,6-diF
14-472	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CH <sub>2</sub>
14-473	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHMe
14-474	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHE t
14-475	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHPr
14-476	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2->C$ (Me) $_2$
14-477	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHPh
14-478	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	. 2, 2-diPh
14-479	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-0 (CH_2)_30-$
14-480	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-0$ CH <sub>2</sub> C (Me) $_{2}$ CH <sub>2</sub> 0-
14-481	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_2-$
14-482	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_3-$
14-483	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_4-$
14-484	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_5-$
14-485	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-MeS
14-486	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-EtS
14-487	4-Cl-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-PrS
14-488	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-BuS
14-489	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2-MeSO_2$
14-490	4-Cl-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-Ph0

14-491	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-MeO-Ph)
14-492	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-Me-Ph)
14-493	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-F-Ph)
14-494	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2-(4-CF_3-Ph)$
14-495	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-Cl-Ph)
14-496	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(2,4-diF-Ph)
14-497	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-MeO-Ph)
14-498	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-Me-Ph)
14-499	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-F-Ph)
14-500	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2-(4-CF_3-Ph)$
14-501	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-Cl-Ph)
14-502	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(2,4-diF-Ph)
14-503	4-C1-Ph	4-Pyr	H	H
14-504	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2-(4-MeO-Ph)
14-505	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2-(4-Me-Ph)
14-506	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2-(4-F-Ph)
14-507	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	$2-(4-CF_3-Ph)$
14-508	4-Cl-Ph	4-Pyr	H	2-(4-Cl-Ph)
14-509	4-C1-Ph	4-Pyr	H	2-(2, 4-diF-Ph)
14-510	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	H
14-511	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-MeO-Ph)
14-512	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Me-Ph)
14-513	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2- (4-F-Ph)
14-514	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
14-515	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-C1-Ph)
14-516	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
14-517	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	H	H
14-518	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	H

·表 15

化合物番号	R <sup>1</sup>	R²	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
15-1	4-F-Ph	4-Pyr	Me	Н
15-2	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Me
15-3	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Et
15-4	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1-Pr
15-5	4-F-Ph	4-Pyr	Me	1,1-diMe
15-6	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Me
15-7	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2–E t
15-8	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr
15-9	4-F-Ph	4-Pyr	· Me	2-Bu
15-10	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Ally1
15-11	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph
15-12	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Bn
15-13	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Phet
15-14	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diMe
15-15	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-ОН .
15-16	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-MeO
15-17	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-E t O
15-18	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr0
15-19	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (MeO)
15-20	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (Et0)
15-21	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
15-22	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-0xo
15-23	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-F
15-24	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-C1

15-25	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Br
15-26	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-I
15-27	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diF
15-28	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-diCl
15-29	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-diBr
15-30	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Me
15-31	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-E t
15-32	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3-Pr
15-33	4-F-Ph	4-Pyr	Me	3,3-diMe
15-34	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-Me
15-35	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5–E t
15-36	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5-P r
15-37	4-F-Ph	4-Pyr	Me	5,5-diMe
15-38	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Me
15-39	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-E t
15-40	4-F-Ph	4-Pyr	Me	6-Pr
15-41	4-F-Ph	4-Pyr,	Me	6-Ph
15-42	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Me
15-43	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-E t
15-44	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-Pr
15-45	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8,8-diMe
15-46	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8,8-diF
15-47	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8, 8-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -
15-48	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8-0xo
15-49	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Me
15-50	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Et
15-51	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Pr
15-51	4-F-Ph	4-Pyr	Me	8a-Pr
15 - 52	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CH <sub>2</sub>
15-53	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHMe
15-54	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHE t
15-55	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHPr
15-56	4-F-Ph	4-Pyr	Me	$2->C$ (Me) $_2$
15-57	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2->CHPh
15-58	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-diPh
15-59	4-F-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-0 (CH_2)_30-$

15-60	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2, $2-0$ CH <sub>2</sub> C (Me) $_2$ CH <sub>2</sub> 0-
15-61	4-F-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-(CH_2)_2-$
15-62	4-F-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-(CH_2)_3-$
15-63	4-F-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-(CH_2)_4-$
15-64	4-F-Ph	4-Pyr .	Me	$2, 2-(CH_2)_5-$
15-65	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-MeS
15-66	4-F-Ph	4-Pyr	Me·	2-E t S
15-67	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-PrS
15-68	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-BuS
15-69	4-F-Ph	4-Pyr	Me	$2-MeSO_2$
15-70	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph0
15-71	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	1-Me
15-72	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	1-E t
15-73	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	1-Pr
15-74	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	1,1-diMe
15-75	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-Me
15-76	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-E t
15-77	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr
15-78	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-Bu
15-79	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Allyl
15-80	4-Cl-Ph	4-Pyr'.	Me ·	2-Ph
15-81	4-Cl-Ph	4-Pyr	Ме	2-Bn
15-82	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-Phet
15-83	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2,2-diMe
15-84	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-0H
15-85	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Me0
15-86	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-Et0
15-87	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-Pr0
15-88	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (MeO)
15-89	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-di (Et0)
15-90	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
15-91	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-0x0
15-92	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-F
15-93	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-C1
15-94	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-Br
15-95	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-I

2, 2-diCl 2, 2-diBr 3-Me 3-Et 3-Pr 3, 3-diMe 5-Me 5-Et 5-Pr 5, 5-diMe 6-Me 6-Et 6-Pr 6, 6-diMe
3-Me 3-Et 3-Pr 3,3-diMe 5-Me 5-Et 5-Pr 5,5-diMe 6-Me 6-Et 6-Pr 6,6-diMe
3-Et 3-Pr 3, 3-diMe 5-Me 5-Et 5-Pr 5, 5-diMe 6-Me 6-Et 6-Pr 6, 6-diMe
3-Pr 3, 3-diMe 5-Me 5-Et 5-Pr 5, 5-diMe 6-Me 6-Et 6-Pr 6, 6-diMe
3,3-diMe 5-Me 5-Et 5-Pr 5,5-diMe 6-Me 6-Et 6-Pr 6,6-diMe
5-Me 5-Et 5-Pr 5,5-diMe 6-Me 6-Et 6-Pr 6,6-diMe
5-Et 5-Pr 5,5-diMe 6-Me 6-Et 6-Pr 6,6-diMe
5-Pr 5,5-diMe 6-Me 6-Et 6-Pr 6,6-diMe
5,5-diMe 6-Me 6-Et 6-Pr 6,6-diMe
6-Me 6-Et 6-Pr 6,6-diMe
6-Et 6-Pr 6,6-diMe
6-Pr 6,6-diMe
6,6-diMe
0 0
6-0xo
8-Me
8-Et
8-Pr
8-Ph
8a-Me
8a-Et
8a-Pr
$6, 6-(CH_2)_2-$
6,6-diF
2->CH <sub>2</sub>
2->CHMe
2->CHE t
2->CHPr
$2->C$ (Me) $_2$
2->CHPh
2, 2-diPh
$2, 2-0 (CH_2)_3 0-$
$2, 2-0$ CH $_2$ C (Me) $_2$ CH $_2$ 0-
$2, 2-(CH_2)_2-$
2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -

15-132	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-(CH_2)_4-$
15-133	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$2, 2-(CH_2)_5-$
15-134	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-MeS
15-135	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-EtS
15-136	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-PrS
15-137	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-BuS
15-138	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	$2-MeSO_2$
15-139	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-Ph0
15-140	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-MeO-Ph)
15-141	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Me-Ph)
15-142	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-F-Ph)
15-143	4-F-Ph	4-Pyr	Me	$2-(4-CF_3-Ph)$
15-144	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Cl-Ph)
15-145	4-F-Ph	4-Pyr	Me	2-(2,4-diF-Ph)
15-146	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	Me	2-(4-MeO-Ph)
15-147	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	Me	2-(4-Me-Ph)
15-148	$3-CF_3-Ph$	4-Pyr	Me	2-(4-F-Ph)
15-149	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	$2-(4-CF_3-Ph)$
15-150	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(4-C1-Ph)
15-151	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Pyr	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
15-152	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	. Me	2->CH <sub>2</sub>
15-153	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHMe
15-154	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHE t
15-155	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHP r
15-156	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2->C$ (Me) $_2$
15-157	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHPh
15-158	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-diPh
15-159	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-0 (CH_2)_3 0-$
15-160	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, $2-OCH_2C$ (Me) $_2CH_2O-$
15-161	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -
15-162	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_3-$
15-163	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_4-$
15-164	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_5-$
15-165	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-MeS
15-166	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-EtS
15-167	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-PrS

15-168	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-BuS
15-169	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2-MeSO_2$
15-170	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Ph0
15-171	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-Me
15-172	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-E t
15-173	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1-Pr
15-174	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	1,1-diMe
15-175	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Me
15-176	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-E t
15-177	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Pr
15-178	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Bu
15-179	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Allyl
15-180	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Ph
15-181	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Bn
15-182	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Phet
15-183	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-diMe
15-184	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-0H
15-185	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-MeO
15-186	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me .	2-Et0
15-187	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Pr0
15-188	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-di(MeO)
15-189	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-di (EtO)
15-190	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-0CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> 0-
15-191	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-0x0
15-192	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-F
15-193	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-C1
15-194	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Br
15-195	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-I
15-196	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-diF
15-197	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-diCl
15-198	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2,2-diBr
15-199	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	3-Me
15-200	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	3-E t
15-201	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	3-Pr
15-202	4-C1-Ph	$\cdot$ 2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	3,3-diMe
15-203	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5-Me

15-204	4-Cl-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	5-Et
15-205	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5-Pr
15-206	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	5,5-diMe
15-207	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-Me
15-208	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-Et
15-209	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-Pr
15-210	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6,6-diMe
15-211	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6-0xo
15-212	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Me
15-213	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Et
15-214	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Pr
15-215	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8-Ph
15-216	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Me
15-217	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Et
15-218	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	8a-Pr
15-219	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$6, 6-(CH_2)_2-$
15-220	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	6,6-diF
15-221	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CH <sub>2</sub>
15-222	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHMe
15-223	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHE t
15-224	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me -	2->CHPr··
15-225	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->C (Me) <sub>2</sub>
15-226	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2->CHPh
15-227	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2, 2-diPh
15-228	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-0 (CH_2)_30-$
15-229	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-0$ CH <sub>2</sub> C (Me) $_{2}$ CH <sub>2</sub> 0-
15-230	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_2-$
15-231	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_3-$
15-232	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_4-$
15-233	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2, 2-(CH_2)_5-$
15-234	4-Cl-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-MeS
15-235	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me.	2-EtS
15-236	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-PrS
15-237	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-BuS
15-238	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-MeSO <sub>2</sub>
15-239	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-Ph0

15-240	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-MeO-Ph)
15-241	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-Me-Ph)
15-242	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-F-Ph)
15-243	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2-(4-CF_3-Ph)$
15-244	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-Cl-Ph)
15-245	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
15-246	$3-CF_3-Ph$	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-MeO-Ph)
15-247	3-CF <sub>3</sub> -Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	Me	2-(4-Me-Ph)
15-248	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-F-Ph)
15-249	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	$2-(4-CF_3-Ph)$
15-250	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(4-Cl-Ph)
15-251	3-CF <sub>3</sub> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
15-252	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	H
15-253	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Me0-Ph)
15-254	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Me-Ph)
15-255	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-F-Ph)
15-256	4-C1-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-CF <sub>3</sub> -Ph)
15-257	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-(4-Cl-Ph)
15-258	4-Cl-Ph	4-Pyr	Me	2-(2, 4-diF-Ph)
15-259	4-C1-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	Me	Н

(I-16)

化合物 番 号	R¹	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R 4
16-1	4-F-Ph	4-Pyr		Н
16-2	4-F-Ph	4-Pyr		Н
16-3	4-F-Ph	4-Pyr	H <sub>3</sub> C N	Н
16-4	4-F-Ph	4-Pyr		Н
16-5	4-F-Ph	4-Pyr	H <sub>3</sub> C N	Н
16-6	4-F-Ph	4-Pyr		Н
16-7	4-F-Ph	4-Pyr		Н
16-8	4-F-Ph	4-Pyr		Н
16-9	4-F-Ph	4-Pyr	N	Н
16-10	4-F-Ph	4-Pyr		Н
16-11	4-F-Ph	4-Pyr		Н

表16 (続き)

16-12	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
16-13	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
16-14	4-F-Ph	4-Pyr	H <sub>3</sub> C N	Ме
16-15	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
16-16	4-F-Ph	4-Pyr	H <sub>3</sub> C N	Ме
16-17	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
16-18	4-F-Ph	.4-Pyr		Ме
16-19	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
16-20	4-F-Ph	4-Pyr	N	Ме
16-21	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
16-22	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
16-23	4-F-Ph	4-Pyr	HO	Н
16-24	4-F-Ph	4-Pyr	HO	Ме
16-25	4-F-Ph	4-Pyr		Н

(1-17)

化合物 番号	R 1	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R 4
17-1	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
17-2	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
17-3	4-F-Ph	4-Pyr	H <sub>3</sub> C N	Ме
17-4	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
17-5	4-F-Ph	4-Pyr	H <sub>3</sub> C N	Ме
17-6	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
17-7	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
17-8	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
17-9	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
17-10	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
17-11	4-F-Ph	4-Pyr		Ме
17-12	4-F-Ph	4-Pyr	HO	Ме

表 18

化合物番 号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	A	R <sup>5</sup>
18-1	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	Н
18-2	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	H
18-3	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	H
18-4	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	H
18-5	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	H
18-6	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	H
1.8-7	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	H
18-8	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	H
18-9	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	H
18-10	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	H
18-11	4-F-Ph	4-Pyr	環 11	H
18-12	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	H
18-13	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	H
18-14	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	H
18-15	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	H
18-16	4-F-Ph	4-Pyr	環 16	H
18-17	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	H
18-18	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	H
18-19	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	H
18-20	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	H
18-21	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	H
18-22	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	Н
18-23	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	H
18-24	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	H

18-25	4-F-Ph	4-Pyr	. :	環 25	H
18-26	4-F-Ph	4-Pyr		環 26	H
18-27	4-F-Ph	4-Pyr		環 27	H
18-28	4-F-Ph	4-Pyr		環 28	H
18-29	4-F-Ph	4-Pyr		環 29	H
18-30	4-F-Ph	4-Pyr		環 30	H
18-31	4-F-Ph	4-Pyr	, <del>-</del>	環 31	H
18-32	4-F-Ph	4-Pyr		環 32	H
18-33	4-F-Ph	4-Pyr		環 33	H
18-34	4-F-Ph	4-Pyr		環 34	H
18-35	4-F-Ph	4-Pyr		環 35	H
18-36	4-F-Ph	4-Pyr	٠	環 36	H
18-37	4-F-Ph	4-Pyr		環 37	H
18-38	4-F-Ph	4-Pyr		環 1	2-Me
18-39	4-F-Ph	4-Pyr		環 2	2-Me
18-40	4-F-Ph	4-Pyr		環 3	2-Me
18-41	4-F-Ph	4-Pyr		環 4	2-Me
18-42	4-F-Ph	4-Pyr		環 5	2-Me
18-43	4-F-Ph	4-Pyr		環 6	2-Me
18-44	4-F-Ph	4-Pyr		環 7	2-Me
18-45	4-F-Ph	4-Pyr	**	環 8	2-Me
18-46	4-F-Ph	4-Pyr		環 9	2-Me
18-47	4-F-Ph	4-Pyr		環 10	2-Me
18-48	4-F-Ph	4-Pyr		環 11	2-Me
18-49	4-F-Ph	4-Pyr		環 12	2-Me
18-50	4-F-Ph	4-Pyr		環 13	2-Me
18-51	4-F-Ph	4-Pyr		環 14	2-Me
18-52	4-F-Ph	4-Pyr		環 15	2-Me
18-53	4-F-Ph	4-Pyr		環 16	2-Me
18-54	4-F-Ph	4-Pyr		環 17	2-Me
18-55	4-F-Ph	4-Pyr		環 18	2-Me
18-56	4-F-Ph	4-Pyr		環 19	2-Me
18-57	4-F-Ph	4-Pyr		環 20	2-Me
18-58	4-F-Ph	4-Pyr		環 21	2-Me
18-59	4-F-Ph	4-Pyr		環 22	2-Me
18-60	4-F-Ph	4-Pyr		環 23	2-Me

18-61	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	2-Me
18-62	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	2-Me
18-63	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	2-Me
18-64	4-F-Ph	4-Pyr ·	環 27	2-Me
18-65	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	2-Me
18-66	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	2-Me
18-67	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	2-Me
18-68	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	2-Me
18-69	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	2-Me
18-70	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	2-Me
18-71	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	2-Me
18-72	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	2-Me
18-73	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	2-Me
18-74	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2-Me
18-75	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	2-0H
18-76	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	2-0H
18-77	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	2-0H
18-78	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	2-0H
18-79	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	2-0H
18-80	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	2-0H
18-81	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	2-0H
18-82	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	2-0H
18-83	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	2-0H
18-84	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	2-0H
18-85	4-F-Ph	4-Pyr	環 11	2-0H
18-86	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	2-0H
18-87	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	2-0H
18-88	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	2-0H
18-89	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	2-0H
18-90	4-F-Ph	4-Pyr	環 16	2-0H
18-91	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	2-0H
18-92	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	2-0H
18-93	4- <b>F-</b> Ph	4-Pyr	環19	2-0H
18-94	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	2-0H
18-95	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	2-0H
18-96	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	2-0H

WO 03/015781 PCT/JP02/08276

18-97	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	2-0H
18-98	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	2-0H
18-99	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	2-0H
18-100	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	2-0H
18-101	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	2-0H
18-102	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	2-0H
18-103	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	2-0H
18-104	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	2-0H
18-105	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	2-0H
18-106	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	2-0H
18-107	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	2-0H
18-108	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	2-0H
18-109	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	2-0H
18-110	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	2-0H
18-111	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2-0H
18-112	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	2-MeO
18-113	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	2-Me0
18-114	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	2-Me0
18-115	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	2-Me0
18-116	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	2-Me0
18-117	4-F-Ph	.4-Pyr	環 6	2-MeO
18-118	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	2-Me0
18-119	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	2-Me0
18-120	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	2-Me0
18-121	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	2-MeO
18-122	4-F-Ph	4-Pyr	環 11	2-Me0
18-123	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	2-Me0
18-124	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	2-Me0
18-125	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	2-Me0
18-126	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	2-Me0
18-127	4-F-Ph	4-Pyr	環 16	2-Me0
18-128	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	2-MeO
18-129	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	2-MeO
18-130	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	2-MeO
18-131	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	2-MeO
18-132	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	2-MeO
•				

18-133	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	2-Me0
18-134	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	2-MeO
18-135	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	2-Me0
18-136	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	2-Me0
18-137	4-F-Ph.	4-Pyr	環 26	2-Me0
1.8-138	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	2-Me0
18-139	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	2-MeO
18-140	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	2-Me0
18-141	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	2-Me0
18-142	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	2-Me0
18-143	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	2-Me0
18-144	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	2-MeO
18-145	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	2-Me0
18-146	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	2-Me0
18-147	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	2-Me0
18-148	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2-Me0
18-149	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	2-F
18-150	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	2-F
18-151	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	2-F
18-152	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	2-F
18-153	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	2-F
18-154	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	2-F
18-155	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	2-F
18-156	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	2-F
18-157	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	2-F
18-158	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	2-F
18-159	4-F-Ph	4-Pyr	環 11	2-F
18-160	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	2-F
18-161	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	2-F
18-162	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	2-F
18-163	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	2-F
18-164	4-F-Ph	4-Pyr	環 16	2-F
18-165	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	2-F
18-166	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	2 <b>-</b> F
18-167	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	2- <b>F</b>
18-168	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	2-F

18-169	4-F-Ph	4-Pyr	環2	21 2-F
18-170	4-F-Ph	4-Pyr	環分	22 . 2-F
18-171	4-F-Ph	4-Pyr	環:	23 2-F
18-172	4-F-Ph	4-Pyr	環2	24 2-F
18-173	4-F-Ph	4-Pyr	環	25 2-F
18-174	4-F-Ph	4-Pyr	環:	26 2-F
18-175	4-F-Ph	4-Pyr	環等	27 2-F
18-176	4-F-Ph	4-Pyr	環	28 · 2-F ·
18-177	4-F-Ph	4-Pyr	環等	29 2-F
18-178	4-F-Ph	4-Pyr	環等	30 2-F
18-179	4-F-Ph	4-Pyr	環	31 2-F
18-180	4-F-Ph	4-Pyr	環:	32 2-F
18-181	4-F-Ph	4-Pyr	環	33 2-F
18-182	4-F-Ph	4-Pyr	環	34 2-F
18-183	4-F-Ph	4-Pyr	環	35 2-F
18-184	4-F-Ph	4-Pyr	環	36 2-F
18-185	4-F-Ph	4-Pyr	環	37 2-F
18-186	4-F-Ph	4-Pyr	環	1 2-C1
18-187	4-F-Ph	4-Pyr	環	2 2-C1
18-188	4-F-Ph	4-Pyr	環	
18-189	4-F-Ph	4-Pyr	***	4 2-C1
18-190	4-F-Ph	4-Pyr		5 2-C1
18-191	4-F-Ph	4-Pyr	環	6 2-C1
18-192	4-F-Ph	4-Pyr	環	7 2-C1
18-193	4-F-Ph	4-Pyr		8 2-C1
18-194	4-F-Ph	4-Pyr	環	9 2-C1
18-195	4-F-Ph	4-Pyr	環	
18-196	4-F-Ph	4-Pyr	環	
18-197	4-F-Ph	4-Pyr	環	
18-198	4-F-Ph	4-Pyr	環	
18-199	4-F-Ph	4-Pyr	環	
18-200	4-F-Ph	4-Pyr	環	
18-201	4-F-Ph	4-Pyr	環	
18-202	4-F-Ph	4-Pyr		17 2-Cl
18-203	4-F-Ph	4-Pyr		18 2-Cl
18-204	4-F-Ph	4-Pyr	環	19 2-Cl

18-205	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	2-C1
18-206	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	2-C1
18-207	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	2-C1
18-208	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	2-C1
18-209	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	2-C1
18-210	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	2-C1
18-211	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	2-C1
18-212	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	2-C1
18-213	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	2-C1
18-214	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	2-C1
18-215	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	2-C1
18-216	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	2-C1
18-217	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	2-C1
18-218	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	2-C1
18-219	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	2-C1
18-220	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	2-C1
18-221	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	2-C1
18-222	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2-C1
18-223	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	2, 2-d i F
18-224	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	2, 2-diF
18-225	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	2, 2-diF
18-226	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	2, 2-d i F
18-227	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	2, 2-d i F
18-228	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	2, 2-d i F
18-229	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	2, 2-diF
18-230	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	2, 2-d i F
18-231	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	2, 2-diF
18-232	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	2, 2-diF
18-233	4-F-Ph	4-Pyr	環 11	2, 2-diF
18-234	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	2, 2-d i F
18-235	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	2, 2-d i F
18-236	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	2, 2-diF
18-237	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	2, 2-d i F
18-238	4-F-Ph		環 16	2, 2-diF
18-239	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	2, 2-diF
18-240	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	2, 2-diF

18-241	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	2,2-diF
18-242	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	2,2-diF
18-243	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	2, 2-diF
18-244	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	2,2-diF
.18-245	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	2, 2-diF
18-246	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	2,2-diF
18-247	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	2, 2-diF
18-248	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	2, 2-diF
18-249	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	2, 2-diF
18-250	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	2, 2-diF
18-251	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	2, 2-diF
18-252	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	2,2-diF
18-253	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	2, 2-diF
18-254	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	2, 2-diF
18-255	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	2, 2-diF
18-256	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	2, 2-diF
18-257	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	2, 2-diF
18-258	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	2, 2-diF
18-259	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2, 2-diF
18-260	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	8-Me
18-261	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	8-Me
18-262	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	8-Me
18-263	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	8-Me
18-264	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	8-Me
18-265	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	8-Me
18-266	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	8-Me
18-267	4-F-Ph	4– <u>.</u> Py r	環 8	8-Me
18-268	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	8-Me
18-269	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	8-Me
18-270	4-F-Ph	4-Pyr	環11	8-Me
18-271	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	8-Me
18-272	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	8-Me
18-273	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	8-Me
18-274	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	8-Me
18-275	4-F-Ph	4-Pyr	環 16	8-Me
18-276	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	8-Me

18-277	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	8-Me
18-278	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	8-Me
18-279	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	8-Me
18-280	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	8-Me
18-281	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	8-Me
18-282	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	8-Me
18-283	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	8-Me
18-284	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	8-Me
18 - 285	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	8-Me
18-286	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	8-Me
18-287	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	8-Me
18-288	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	8-Me
18-289	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	8-Me
18-290	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	8-Me
18-291	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	8-Me
18-292	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	8-Me
18-293	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	8-Me
18-294	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	8-Me
18-295	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	8-Me
18-296	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	8-Me
18-297	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	H
18-298	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	H
18-299	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	H
18-300	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	H
18-301	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	H
18-302	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	H
18-303	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	H
18-304	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	H
18-305	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	H
18-306	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	H
18-307	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 11	H
18-308	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	H
18-309	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	H
18-310	4-F-Ph	• •	環 14	H
18-311	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	H
18-312	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	H

18-313	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	Н -
18-314	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18·	Н.
18-315	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 19	H
18-316	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 20	H
18-317	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 21	Н
18-318	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	H
18-319	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	H
18-320	4-F-Ph - 1	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	H
18-321	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	H
18-322	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 26	Н
18-323	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 27	H
18-324	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 28	H
18-325	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 29	H
18-326	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	H
18-327	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	H
18-328	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	H
18-329	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	H
18-330	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	H
18-331	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 35	H
18-332	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	. Н
18-333	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	. Н
18-334	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	2-Me
18-335	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2-Me
18-336	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-Me
18-337	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 4	2-Me
18-338	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 5	2-Me
18-339	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-Me
18-340	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 7	2-Me
18-341	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 8	2-Me
18-342	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 9	2-Me
18-343	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 10	2-Me
18-344	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環11	2-Me
18-345	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2-Me
18-346	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 13	2-Me
18-347	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 14	2-Me
18-348	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2-Me

18-349	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2-Me
18-350	4- <b>F</b> -Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-Me
18-351	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-Me
18-352	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2-Me
18-353	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-Me
18-354	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-Me
18-355	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2-Me
18-356	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-Me
18-357	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-Me
18-358	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-Me
18-359	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2-Me
18-360	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2-Me
18-361	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2-Me
18-362	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2-Me
18-363	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2-Me
18-364	4-F-Ph	$2-NH_2-4-\dot{P}$ ym	環 31	2-Me
18-365	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2-Me
18-366	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2-Me
18-367	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2-Me
18-368	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2-Me
18-369	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2-Me
18-370	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2-Me
18-371	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 1	2-0H
18-372	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2-0H
18-373	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-0H
18-374	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 4	2-0H
18-375	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2-0H
18-376	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-0H
18-377	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2-0H
18-378	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2-0H
18-379	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2-0H
18-380	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	2-0H
18-381	4-F-Ph	$2\mathrm{-NH_2}\mathrm{-}4\mathrm{-Pym}$	環 11	2-0H
18-382	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2-0H
18-383	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環13	2-0H
18-384	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2-0H

18-385	4-F-Ph	$2-NH_2-4-\dot{P}$ ym	環 15	2-0H
18-386	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環16	2-0H
18-387	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-0H
18-388	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-0H
18-389	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環19	2-0H
18-390	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-0H
18-391	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-0H
18-392	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 22	2-0H
18-393	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-0H
18-394	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-0H
18-395	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-0H
18-396	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2-0H
18-397	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2-0H
18-398	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2-0H
18-399	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2-0H
18-400	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2-0H
18-401	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2-0H
18-402	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2-0H
18-403	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2-0H
18-404	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 34	2-0H
18-405	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環'35	2-0H ··
18-406	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 36	2-0H
18-407	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2-0H
18-408	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環1	2-Me0
18-409	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2-MeO
18-410	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-Me0
18-411	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2-MeO
18-412	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2-MeO
18-413	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-MeO
18-414	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2-Me0
18-415	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2-MeO
18-416	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 9	2-Me0
18-417	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	2-Me0
18-418	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 11	2-Me0
18-419	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2-MeO
18-420	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 13	2-MeO

18-421	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2-Me0
18-422	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2-Me0
18-423	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2-Me0
18-424	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-MeO
18-425	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-MeO
18-426	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2-MeO
18-427	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-Me0
18-428	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-Me0
18-429	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2-MeO
18-430	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-Me0
18-431	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-MeO
18-432	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-Me0
18-433	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2-Me0
18-434	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2-Me0
18-435	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2-Me0
18-436	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2-MeO
18-437	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2-Me0
18-438	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2-Me0
18-439	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2-Me0
18-440	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2-Me0
18-441	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2-Me0
18-442	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2-Me0
18-443	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2-Me0
18-444	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2-MeO
18-445	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	2-F
18-446	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2-F
18-447	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-F
18-448	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2-F
18-449	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2-F
18-450	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-F
18-451	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2-F
18-452	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2-F
18-453	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2-F
18-454	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	2-F
18-455	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 11	2-F
18-456	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2-F

18-457	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	2-F
18-458	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2-F
18-459	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2-F
18-460	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2-F
18-461	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-F
18-462	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-F
18-463	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2-F
18-464	4-F-Ph -	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-F
18-465	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-F
18-466	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2-F
18-467	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-F
18-468	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-F
18-469	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-F
18-470	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2-F
18-471	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2-F
18-472	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2-F
18-473	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2-F
18-474	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2-F
18-475	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2-F
18-476	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2-F
18-477	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	, 2-F
18-478	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2-F
18-479	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2F
18-480	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2-F
18-481	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2-F
18-482	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 1	2-C1
18-483	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 2	2-C1
18-484	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-C1
18-485	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2-C1
18-486	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2-C1
18-487	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-C1
18-488	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2-C1
18-489	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2-C1
18-490	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2-C1
18-491	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	2-C1
18-492	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 11	2-C1

WO 03/015781 PCT/JP02/08276 218

18-493	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2-C1
18-494	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	2-C1
18-495	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2-C1
18-496	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2-C1
18-497	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2-C1
18-498	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-C1
18-499	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-C1
18-500	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2-C1
18-501	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-C1
18-502	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-C1
18-503	4F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2-C1
18-504	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-C1
18-505	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-C1
18-506	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-C1
18-507	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2-C1
18-508	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2-C1
18-509	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2-C1
18-510	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2-C1
18-511	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2-C1
18-512	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	<sup>*</sup> 環 31	2-C1
18-513	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2-C1
18-514	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2-C1
18-515	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2-C1
18-516	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2-C1
18-517	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2-C1
18-518	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2-C1
18-519	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	2, 2-diF
18-520	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2,2-diF
18-521	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2, 2-d i F
18-522	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2,2-diF
18-523	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2,2-diF
18-524	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2,2-diF
18-525	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2,2-diF
18-526	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2,2-diF
18-527	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2, 2-diF
18-528	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	2, 2-diF

•				
18-529	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環11	2,2-diF
18-530	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2, 2-diF
18-531	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	2,2-diF
18-532	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2, 2-d i F
18-533	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2, 2-diF
18-534	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2, 2-d i F
18-535	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2, 2-d i F
18-536	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	. 2, 2-diF
18-537	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2, 2-d i F
18-538	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2, 2-d i F
18-539	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2, 2-diF
18-540	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2, 2-diF
18-541	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2, 2-diF
18-542	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2, 2-d i F
18-543	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2,2-diF
18-544	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2, 2-d i F
18-545	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2, 2-diF
18-546	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2, 2-d i F
18-547	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2, 2-d i F
18-548	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2, 2-diF
18-549	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2, 2-diF
18-550	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2, 2-diF
18-551	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2, 2-diF
18-552	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2, 2-d i F
18-553	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2, 2-diF
18-554	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2, 2-diF
18-555	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2, 2-diF
18-556	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	8-Me
18-557	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	8-Me
18-558	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	8-Me
18-559	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	8-Me
18-560	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	· 環 5	8-Me
18-561	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	8-Me
18-562	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	8-Me
18-563	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	8-Me
18-564	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	8-Me

18-565	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環10	8-Me
18-566	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 11	8-Me
18-567	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環12	8-Me
18-568	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	8-Me
18-569	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	8-Me
18-570	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	8-Me
18-571	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	8-Me
18-572	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	8-Me
18-573	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	8-Me
18-574	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	8-Me
18-575	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	8-Me
18-576	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	8-Me
18-577	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	8-Me
18-578	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	8-Me
18-579	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	8-Me
18-580	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	8-Me
18-581	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	8-Me
18-582	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	8-Me
18-583	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	8-Me
18-584	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	8-Me
18-585	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	8-Me
18-586	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	8-Me
18-587	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	8-Me
18-588	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	8-Me
18-589	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	8-Me
18-590	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	8-Me
18-591	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	8-Me
18-592	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	8-Me
18-593	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	H
18-594	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	H
18-595	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	H
18-596	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	H
18-597	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	H
18-598	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	H
18-599	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	H
18-600	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	H

WO 03/015781 PCT/JP02/08276

18-601	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	H
18-602	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	H
18-603	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環11	H
18-604	4-F-Ph.	2-MeNH-4-Pym	環 12	H
18-605	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13.	H
18-606	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	H
18-607	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	H
18-608	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	Н
18-609	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	H
18-610	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	H
18-611	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	H
18-612	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	H
18-613	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	H
18-614	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	H
18-615	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	H
18-616	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	H
18-617	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	H
18-618	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	H
18-619	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	H
18-620	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	H
18-621	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	- 環 29	H
18-622	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	H
18-623	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	H
18-624	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	、 環 32	H
18-625	4-F-Ph '	2-MeNH-4-Pym	環 33	H
18-626	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	H
18-627	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	H
18-628	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	H
18-629	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	H
18-630	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-Me
18-631	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2-Me
18-632	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-Me
18-633	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-Me
18-634	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-Me
18-635	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-Me
18-636	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-Me

18-637	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-Me
18-638	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2-Me
18-639	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-Me
18-640	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環11	2-Me
18-641	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2-Me
18-642	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-Me
18 <del>-</del> 643	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2-Me
18-644	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-Me
18-645	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環16	2-Me
18-646	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-Me
18-647	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-Me
18-648	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-Me
18-649	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2-Me
18-650	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-Me
18-651	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-Me
18-652	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	· 2-Me
18-653	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2-Me
18-654	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-Me
18-655	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-Me
18-656	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-Me
18-657	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-Me
18-658	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-Me
18-659	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2-Me
18-660	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-Me
18-661	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-Me
18-662	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2-Me
18-663	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-Me
18-664	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-Me
18-665	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-Me
18-666	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-Me
18-667	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-0H
18-668	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2-0H
18-669	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-0H
18-670	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-0H
18-671	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-0H
18-672	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-0Н

18-673	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-0H
18-674	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-0H
18-675	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2-0H
18-676	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-0H
18-677	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環11	2-0H
18-678	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2-0H
18-679	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-0H
18-680	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2-0H
18-681	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-0H
18-682	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2-0H
18-683	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-0H
18-684	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-0H
18-685	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-0H
18-686	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2-0H
18-687	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-0H
18-688	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-0H
18-689	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2-0H
18-690	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2-0H
18-691	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-0H
18-692	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-0H
18-693	4-F-Ph '	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-0H
18-694	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-0H
18-695	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-0H
18-696	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2-0H
18-697	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-0H
18-698	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-0H
18-699	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2-0H
18-700	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-0H
18-701	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-0H
18-702	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-0H
18-703	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-0H
18-704	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-MeO
18-705	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2-MeO
18-706	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-MeO
18-707	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-MeO
18-708	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-MeO

18-709	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-MeO
18-710	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-MeO
18-711	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-MeO
18-712	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2-MeO
18-713	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-MeO
18-714	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環11	2-MeO
18-715	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2-MeO
18-716	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-Me0
18-717	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2-MeO
18-718	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-Me0
18-719	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2-Me0
18-720	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-MeO
18-721	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-MeO
18-722	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-MeO
18-723	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2-Me0
18-724	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-MeO
18-725	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-MeO
18-726	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2-MeO
18-727	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2-MeO
18-728	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-MeO
18-729	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-MeO
18-730	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-Me0
18-731	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-MeO
18-732	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-MeO
18-733	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2-Me0
18-734	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-Me0
18-735	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-Me0
18-736	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2-Me0
18-737	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-Me0
18-738	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-Me0
18-739	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-MeO
18-740	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-Me0
18-741	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-F
18-742	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2-F
18-743	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-F
18-744	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-F
	•			

18-745	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-F
18-746	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-F
18-747	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-F
18-748	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-F
18-749	4-F-Ph .	2-MeNH-4-Pym	環 9	2-F
18-750	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-F
18-751	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環11	2-F
18-752	4-F-Ph.	2-MeNH-4-Pym	環12	2-F
18-753	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-F
18-754	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	- 環 14	2-F
18-755	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-F
18-756	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2-F
18-757	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-F
18-758	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-F
18-759	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-F
18-760	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2-F
18-761	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-F
18-762	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-F
18-763	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2-F
18-764	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2-F
18-765	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-F
18-766	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-F
18-767	4-F-Ph .	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-F
18-768	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-F
18-769	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-F
18-770	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2-F
18-771	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-F
18-772	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-F
18-773	4- <b>F</b> -Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2-F
18-774	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-F
18-775	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-F
18-776	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-F
18-777	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-F
18-778	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-C1
18-779	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2-C1
18-780	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-C1

18-781	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-C1
18-782	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-C1
18-783	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-C1
18-784	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-C1
18-785	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-C1
18-786	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2-C1
18-787	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-C1
18-788	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	2-C1
18-789	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2-C1
18-790	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-C1
18-791	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2-C1
18-792	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-C1
18-793	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2-C1
18-794	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-C1
18-795	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-C1
18-796	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-C1
18-797	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2-C1
18-798	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-C1
18-799	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-C1
18-800	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2-C1
1.8-801	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2-C1
18-802	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-C1
18-803	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-C1
18-804	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-C1
18-805	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-C1
18-806	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-C1
18-807	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2-C1
18-808	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-C1
18-809	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-C1
18-810	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2-C1
18-811	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-C1
18-812	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-C1
18-813	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-C1
18-814	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-C1
18-815	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2,2-diF
18-816	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2, 2-diF

18-817	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2,2-diF
18-818	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2,2-diF
18-819	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2,2-diF
18-820	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2, 2-diF
18-821	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2, 2-d i F
18-822	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2, 2-d i F
18-823	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2, 2-diF
18-824	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2,2-diF
18-825	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	2,2-diF
18-826	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2,2-diF
18-827	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2, 2-diF
18-828	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2,2-diF
18-829	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2, 2-diF
18-830	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2, 2-diF
18-831	4–F–Ýh	2-MeNH-4-Pym	環 17	2,2-diF
18-832	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2,2-diF
18-833	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2,2-diF
18-834	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2,2-diF
18-835	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2,2-diF
18-836	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2,2-diF
18-837	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2,2-diF
18-838	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2,2-diF
18-839	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2,2-diF
18-840	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2,2-diF
18-841	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2,2-diF
18-842	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2,2-diF
18-843	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2,2-diF
18-844	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2,2-diF
18-845	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2,2-diF
18-846	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2,2-diF
18-847	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2,2-diF
18-848	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2,2-diF
18-849	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2,2-diF
18-850	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2,2-diF
18-851	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2,2-diF
18-852	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	8-Me

18-853	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	8-Me
18-854	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	8-Me
18-855	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	8-Me
18-856	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	8-Me
18-857	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	8-Me
18-858	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	8-Me
18-859	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	8-Me
18-860	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	8-Me
18-861	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	8-Me
18-862	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	8-Me
18-863	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	8-Me
18-864	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	8-Me
18-865	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	8-Me
18-866	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	8-Me
18-867	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	8-Me
18-868	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	8-Me
18-869	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	8-Me
18-870	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	8-Me
18-871	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	8-Me
18-872	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	8-Me
18-873	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	8-Me
18-874	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	8-Me.
18-875	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	8-Me
18-876	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	8-Me
18-877	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	8-Me
18-878	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	8-Me
18-879	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	8-Me
18-880	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	8-Me
18-881	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	8-Me
18-882	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	8-Me
18-883	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	8-Me
18-884	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	8-Me
18-885	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	8-Me
18-886	4~F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	8-Me
18-887	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	8-Me
18-888	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	8-Me

18-889	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 1	H
18-890	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 2	H
18-891	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 3	H
18-892	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 4	H
18-893	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 5	H
18-894	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 6	H
18-895	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 7	H
18-896	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 8	H
18-897	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 9	H
18-898	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-$ 4-Pym	環 10	H
18-899	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 11	H
18-900	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 12	H
18-901	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 13	H
18-902	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 14	H
18-903	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 15	H
18-904	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 16	H
18-905	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 17	H
18-906	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 18	H
18-907	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 19	H
18-908	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	H
18-909	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 21	H
18-910	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 22	H
18-911	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	H
18-912	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 24	H
18-913	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	,環 25	H
18-914	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 26	, H
18-915	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 27	H
18-916	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	H
18-917	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 29	H
18-918	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 30	H
18-919	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 31	H
18-920	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 32	H
18-921	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 33	H
18-922	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	H
18-923	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 35	H
18-924	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 36	H

18-925	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 37	H
18-926	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 1	2-Me
18-927	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	2-Me
18-928	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 3	2-Me
18-929	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 4	2-Me
18-930	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 5	2-Me
18-931	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 6	2-Me
18-932	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 7	2-Me
18-933	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 8	2-Me
18-934	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 9	2-Me
18-935	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	2-Me
18-936	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 11	2-Me
18-937	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 12	2-Me
18-938	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 13	2-Me
18-939	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 14	2-Me
18-940	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 15	2-Me
18-941	4-F-Ph	$2-(\alpha-\text{Me-BnNH})-4-\text{Pym}$	環 16	2-Me
18-942	4-F-Ph	$2-(\alpha-\text{Me-BnNH})-4-\text{Pym}$	環 17	2-Me
18-943	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 18	2-Me
18-944	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 19	2-Me
18-945	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	2-Me
18-946	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 21	2-Me
18-947	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 22	2-Me
18-948	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 23	2-Me
18-949	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 24	2-Me
18-950	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 25	2-Me
18-951	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 26	2-Me
18-952	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 27	2-Me
18-953	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	2-Me
18-954	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 29	2-Me
18-955	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 30	2-Me
18-956	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 31	2-Me
18-957	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 32	2-Me
18-958	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 33	2-Me
18-959	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	2-Me
18-960	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 35	2-Me

WO 03/015781 PCT/JP02/08276

10 001	4 P DL	O / a. Ma DaMII) / Derm	700 00	9 Ma
18-961	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 36	2-Me
18-962	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 37	2-Me
18-963	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 1	2-0H
18-964	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	2-0H
18-965	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 3	2-0H
18-966	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 4	2-0H
18-967	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 5	2-0H
18-968	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 6	•= =
18-969	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 7	2-0H
18-970	4-F-Ph	2- ( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 8	2-0H
18-971	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 9	2-0H
18-972	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	2-0H
18-973	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環11	2-0H
18-974	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 12	2-0H
18-975	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環13	2-0H
18-976	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 14	2-0H
18-977	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 15	2-0H
18-978	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環16	2-0H
18-979	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 17	2-0H
1.8-980	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 18	2-0H
18-981	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 19	· 2-0H
18-982	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	2-0H
18-983	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 21	2-0H
18-984	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 22	2-0H
18-985	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 23	2-0H
18-986	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 24	2-0H
18-987	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 25	2-0H
18-988	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 26	2-0H
18-989	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 27	2-0H
18-990	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	2-0H
18-991	4-F-Ph	2-(α-Me-BnNH)-4-Pym	環 29	2-0H
18-992	4-F-Ph	2-(α-Me-BnNH)-4-Pym	環 30	2-0H
18-993	4-F-Ph	2-(α-Me-BnNH)-4-Pym	環 31	2-0H
18-994	4-F-Ph	$2-(\alpha-\text{Me-BnNH})-4-\text{Pym}$	環 32	2-0H
18-995	4-F-Ph	$2-(\alpha-\text{Me-BnNH})-4-\text{Pym}$	環 33	2-0H
18-996	4-F-Ph	$2-(\alpha - Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	2-0H
		,		

18-997	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 35	2-0H
18-998	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 36	2-0H
18-999	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 37	2-0H
18-1000	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 1	2-Me0
18-1001	4F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	2-Me0
18-1002	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 3	2-Me0
18-1003	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 4	2-Me0
18-1004	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 5	2-MeO
18-1005	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 6	2-MeO
18-1006	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 7	2-Me0
18-1007	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 8	2-Me0
18-1008	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 9	2-MeO
18-1009	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	2-Me0
18-1010	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環11	2-Me0
18-1011	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 12	2-MeO
18-1012	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 13	2-Me0
18-1013	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 14	2-Me0
18-1014	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 15	2-Me0
18-1015	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 16	2-Me0
18-1016	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環17	2-MeO
18-1017	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 18	2-Me0
18-1018	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 19	2-Me0
18-1019	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	2-Me0
18-1020	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 21	2-MeO
18-1021	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 22	2-MeO
18-1022	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	2-MeO
18-1023	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 24	2-MeO
18-1024	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 25	2-MeO
18-1025	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 26	2-MeO
18-1026	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 27	2-Me0
18-1027	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	2-MeO
18-1028	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 29	2-MeO
18-1029	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 30	2-MeO
18-1030	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 31	2-MeO
18-1031	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 32	2-MeO
18-1032	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 33	2-Me0

18-1033	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	2-MeC
18-1034	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 35	2-MeO
18-1035	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 36	2-MeO
18-1036	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 37	2-MeO
18-1037	4-F-Ph-	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 1.	2-F
18-1038	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	2-F
18-1039	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 3	2-F
18-1040	4-F-Ph	2-(α-Me-BnNH)-4-Pym	環 4	2-F
18-1041	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 5	2-F
18-1042	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 6	2-F
18-1043	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 7	2-F
18-1044	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 8	2-F
18-1045	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 9	2-F
18-1046	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環10	2-F
18-1047	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環11	2-F
18-1048	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環12	2-F
18-1049	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 13	2-F
18-1050	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 14	2-F
18-1051	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 15	2-F
1:8-1052	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 16	2-F
18-1053	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環17	: 2-F
18-1054	4-F-Ph	2-(α-Me-BnNH)-4-Pym	環 18	2-F
18-1055	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 19	2-F
18-1056	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	2-F
18-1057	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 21	2-F
18-1058	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 22	2-F
18-1059	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	2-F
18-1060	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 24	2-F
18-1061	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 25	2-F
18-1062	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 26	2-F
18-1063	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 27	2-F
18-1064	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	2-F
18-1065	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 29	2-F
18-1066	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 30	2-F
18-1067	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 31	2-F
18-1068	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 32	2-F

18-1069	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 33	2-F
18-1070	4-F-Ph	$2-(\alpha-\text{Me-BnNH})-4-\text{Pym}$	環 34	2-F
18-1071	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 35	2-F
18-1072	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 36	2-F
18-1073	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 37	2-F
18-1074	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 1	2-C1
18-1075	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	2-C1
18-1076	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 3	2-C1
18-1077	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 4	2-C1
18-1078	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 5	2-C1
18-1079	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 6	2-C1
18-1080	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 7	2-C1
18-1081	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 8	2-C1
18-1082	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 9	2-C1
18-1083	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	2-C1
18-1084	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 11	2-C1
18-1085	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 12	2-C1
18-1086	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 13	2-C1
18-1087	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 14	2-C1
18-1088	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 15	2-C1
18-1089	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 16	2-C1
18-1090	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環17	2-C1
18-1091	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 18	2-C1
18-1092	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 19	2-C1
18-1093	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 20	2-C1
18-1094	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 21	2-C1
18-1095	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 22	2-C1
18-1096	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	2-C1
18-1097	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 24	2-C1
18-1098	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 25	2-C1
18-1099	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 26	2-C1
18-1100	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 27	2-C1
18-1101	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 28	2-C1
18-1102	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 29	2-C1
18-1103	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 30	2-C1
18-1104	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 31	2-C1

∹.

18-1105	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 32	2-C1
18-1106	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 33	2-C1
18-1107	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 34	2-C1
18-1108	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 35	2-C1
18-1109	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 36.	2-C1
18-1110	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 37	2-C1
18-1111	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 1	2,2-diF
18-1112	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環-2	. 2,2-diF
18-1113	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 3	2,2-diF
18-1114	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 4	2,2-diF
18-1115	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 5	2,2-diF
18-1116	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 6	2, 2-diF
18-1117	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 7	2,2-diF
18-1118	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 8	2, 2-diF
18-1119	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 9	2,2-diF
18-1120	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	2,2-diF
18-1121	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環11	2,2-diF
18-1122	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 12	2,2-diF
18-1123	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 13	2,2-diF
18-1124	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 14	2,2-diF
18-1125	4-F-Ph ' '	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	〃環 15	- 2, 2-diF
18-1126	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 16	. 2, 2-diF
18-1127	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 17	2, 2-diF
18-1128	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 18	2, 2-diF
18-1129	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 19	2, 2-diF
18-1130	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	2, 2-diF
18-1131	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 21	2, 2-diF
18-1132	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 22	2, 2-diF
18-1133	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	2, 2-diF
18-1134	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 24	2, 2-diF
18-1135	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 25	2, 2-diF
18-1136	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 26	2, 2-diF
18-1137	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 27	2, 2-diF
18-1138	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	2, 2-diF
18-1139	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 29	2, 2-diF
18-1140	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 30	2, 2-diF

18-1141	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 31	2, 2-d i F
18-1142	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 32	2,2-diF
18-1143	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 33	2, 2-d i F
18-1144	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	2, 2-d i F
18-1145	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 35	2,2-diF
18-1146	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 36	2, 2-d i F
18-1147	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 37	2, 2-d i F
18-1148	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 1	8-Me
18-1149	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	8-Me
18-1150	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 3	8-Me
18-1151	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 4	8-Me
18-1152	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 5	8-Me
18-1153	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 6	8-Me
18-1154	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 7	8-Me
18-1155	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 8	8-Me
18-1156	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 9	8-Me
18-1157	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	8-Me
18-1158	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 11	8-Me
18-1159	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 12	8-Me
18-1160	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 13	8-Me
18-1161	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 14	8-Me
18-1162	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 15	8-Me
18-1163	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 16	8-Me
18-1164	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環17	8-Me
18-1165	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 18	8-Me
18-1166	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 19	8-Me
18-1167	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	8-Me
18-1168	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 21	8-Me
18-1169	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 22	8-Me
18-1170	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	8-Me
18-1171	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 24	8-Me
18-1172	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 25	8-Me
18-1173	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 26	8-Me
18-1174	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 27	8-Me
18-1175	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	8-Me
18-1176	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 29	8-Me

18-1177	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 30	8-Me
18-1178	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 31	8-Me
18-1179	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 32	8-Me
18-1180	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 33	8-Me
18-1181	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 34	8-Me
18-1182	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 35	8-Me
18-1183	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 36	8-Me
18-1184	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 37	8-Me
			•	

表 19

化合物番号	R <sup>1</sup>	R²	A	R <sup>5</sup>
19-1	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	Н
19-2	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	H
19-3	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	H
19-4	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	H .
19-5	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	H
19-6	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	H
19-7	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	H
19-8	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	Н
19-9	4-F-Ph	4-Pyr	環.9	H
19-10	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	H
19-11	4-F-Ph	4-Pyr	環11	H
19-12	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	H
19-13	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	H
19-14	4-F-Ph	4-Pyr	環14	H
19-15	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	Н

19-16	4-F-Ph	4-Pyr	環 16	H
19-17	4-F-Ph	4-Pyr	環17	. Н
19-18	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	H
19-19	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	H
19-20	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	H
19-21	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	H
19-22	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	Н
1.9-23	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	H
19-24	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	H
19-25	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	H
19-26	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	H
19-27	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	H
19-28	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	H
19-29	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	H
19-30	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	H
19-31	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	H
19-32	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	H
19-33	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	H
1.9-34	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	H
19-35	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	H
19-36	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	H
19-37	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	H
19-38	4-F-Ph	4-Pyr	環1	2-Me
19-39	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	2-Me
19-40	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	2-Me
19-41	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	2-Me
19-42	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	2-Me
19-43	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	2-Me
19-44	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	2-Me
19-45	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	2-Me
19-46	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	2-Me
19-47	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	2-Me
19-48	4-F-Ph	4-Pyr	環11	2-Me
19–49	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	2-Me
19-50	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	2-Me
19-51	4-F-Ph	4-Pyr	環14	2-Me

WO 03/015781 PCT/JP02/08276

•				
19-52	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	2-Me
19-53	4-F-Ph	4-Pyr	環16	2-Me
19-54	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	2-Me
19-55	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	2-Me
19-56	4-F-Ph	4-Pyr	. 環19	2-Me
19-57	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	2-Me
19-58	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	2-Me
19-59	4-F-Ph	4-Pyr	環 22.	2-Me
19-60	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	2-Me
19-61	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	2-Me
19-62	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	2-Me
19-63	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	2-Me
19-64	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	2-Me
19-65	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	2-Me
19-66	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	2-Me
19-67	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	2-Me
19-68	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	2-Me
19-69	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	2-Me
19-70	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	2-Me
19-71	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	2-Me
19-72	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	2-Me
19-73	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	2-Me
19-74	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2-Me
19-75	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	2-0H
19-76	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	2-0H
19-77	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	2-0H
19-78	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	2-0H
19-79	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	2-0H
19-80	4-F-Ph	4-Pyr	. 環 6	2-0H
19-81	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	2-0H
19-82	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	2-0H
19-83	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	2-0H
19-84	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	2-OH
19-85	4-F-Ph	4-Pyr	環 11	2-0H
19-86	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	2-0H
19-87	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	2-0H

19-88	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	2-0H
19-89	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	2-0H
19-90	4-F-Ph	4-Pyr	環 16	2-0H
19-91	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	2-0H
19-92	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	2-0H
19-93	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	2-0H
19-94	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	2-0H
19-95	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	2-0H
19-96	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	2-0H
19-97	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	2-0H
19-98	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	2-0H
19-99	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	2-0H
19-100	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	2-0H
19-101	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	2-0H
19-102	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	2-0H
19-103	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	2-0H
19-104	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	2-0H
19-105	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	2-0H
19-106	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	2-0H
19-107	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	2-0H
19-108	· 4-F-Ph	4-Pyr	環 34	2-0H
19-109	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	2-0H
19-110	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	2-0H
19-111	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2-0H
19-112	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	2-Me0
19-113	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	2-Me0
19-114	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	2-Me0
19-115	4-F-Ph	4-Pyr	環 4.	2-Me0
19-116	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	2-Me0
19-117	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	2-Me0
19-118	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	2-Me0
19-119	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	2-Me0
19-120	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	2-Me0
19-121	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	2-Me0
19-122	4-F-Ph	4-Pyr	環11	2-MeO
19-123	4-F-Ph	4-Pyr	環12	2-MeO

19-124	4-F-Ph	4-Pyr		環 13	2-MeO
19-125	4-F-Ph	4-Pyr		環 14	2-MeO
19-126	4-F-Ph	4-Pyr		環 15	2-MeO
19-127	4-F-Ph	4-Pyr		環 16	2-MeO
1.9-128	4-F-Ph	4-Pyr		環 17	2-MeO
19-129	4-F-Ph	4-Pyr	•	環 18	2-Me0
19-130	4-F-Ph	4-Pyr		環 19	2-Me0
19-131	4-F-Ph	4-Pyr		環 20	2-MeO
19-132	4-F-Ph	4-Pyr		環 21	2-Me0
19-133	4-F-Ph	4-Pyr		環 22	2-Me0
19-134	4-F-Ph	4-Pyr		環 23	2-Me0
19-135	4-F-Ph	4-Pyr		環 24	2-Me0
19-136	4-F-Ph	4-Pyr		環 25	2-Me0
19-137	4-F-Ph	4-Pyr		環 26	2-MeO
19-138	4-F-Ph	4-Pyr	•	環 27	2-MeO
19-139	4-F-Ph	4-Pyr		環 28	2-Me0
19-140	4-F-Ph	4-Pyr		環 29	2-Me0
19-141	4-F-Ph	4-Pyr	•	環 30	2-Me0
19-142	4-F-Ph	4-Pyr		環 31	2-Me0
19-143	4-F-Ph	4-Pyr		環 32	2-Me0
19-144	4-F-Ph	4-Pyr	'E	環 33	2-Me0
19-145	4-F-Ph	4-Pyr		環 34	2-MeO
19-146	4-F-Ph	4-Pyr		環 35	2-Me0
19-147	4-F-Ph	4-Pyr		環 36	2-Me0
19-148	4-F-Ph	4-Pyr		環 37	2-Me0
19-149	4-F-Ph	4-Pyr		環 1	2- <b>F</b>
19-150	4-F-Ph	4-Pyr		環 2	2-F
19-151	4-F-Ph	4-Pyr		環 3	2-F
19-152	4-F-Ph `	4-Pyr		環 4	2-F
19-153	4-F-Ph	4-Pyr		環 5	2-F
19-154	4-F-Ph	4-Pyr		環 6	2-F
19-155	4-F-Ph	4-Pyr		環 7	2-F
19-156	4-F-Ph	4-Pyr		環 8	2-F
19-157	4-F-Ph	4-Pyr		環 9	2-F
19-158	4-F-Ph	4-Pyr		環 10	2-F
19-159	4-F-Ph	4-Pyr		環 11	2-F

19-160	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	2-F
19-161	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	2-F
19-162	4-F-Ph	4-Pyr	環14	2-F
19-163	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	2-F
19-164	4-F-Ph	4-Pyr	環16	2-F
19-165	4-F-Ph	4-Pyr	環17	2-F
19-166	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	2-F
19-167	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	2-F
19-168	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	2-F
19-169	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	2-F
19-170	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	2-F
19-171	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	2-F
19-172	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	2-F
19-173	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	2-F
19-174	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	2-F
19-175	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	2-F
19-176	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	2-F
19-177	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	2-F
19-178	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	2-F
19-179	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	2-F
19-180	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	2-F
19-181	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	2-F
19-182	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	2-F
19-183	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	2-F
19-184	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	2-F
19-185	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2-F
19-186	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	2-C1
19-187	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	2-C1
19-188	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	2-C1
19-189	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	2-C1
19-190	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	2-C1
19-191	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	2-C1
19-192	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	2-C1
19-193	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	2-C1
19-194	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	2-C1
19-195	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	2-C1

19-196	4-F-Ph	4-Pyr	環 11	2-C1
19-197	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	2-C1
19-198	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	2-C1
19-199	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	2-C1
19-200	4-F-Ph	4-Pyr :	環 15	2-C1
19-201	4-F-Ph	4-Pyr	環 16	2-C1
19-202	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	2-C1
1.9-203	4-F-Ph	'4-Pyr	環 18	. 2-Cl : : -:
19-204	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	2-C1
19-205	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	2-C1
19-206	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	2-C1
19-207	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	2-C1
19-208	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	2-C1
19-209	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	2-C1
19-210	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	_2-C1
19-211	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	2-C1
19-212	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	2-C1
19-213	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	2-C1
1.9-214	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	2-C1
19-215	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	2-C1
19-216	4-F-Ph	4-Pýr	環 31	2-Cl
19-217	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	2-C1
19-218	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	2-C1
19-219	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	2-C1
19-220	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	2-C1
19-221	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	2-C1
19-222	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2-C1
19-223	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	2, 2-diF
19-224	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	2, 2-diF
19-225	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	2, 2-diF
19-226	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	2, 2-diF
19-227	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	2, 2-diF
19-228	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	2,2-diF
19-229	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	2, 2-diF
19-230	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	2, 2-diF
19-231	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	2, 2-diF

19-232	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	2,2-diF
19-233	4-F-Ph	4-Pyr	環11	2,2-diF
19-234	4-F-Ph	4-Pyr	環12	2,2-diF
19-235	4-F-Ph	4-Pyr	環13	2, 2-diF
19-236	4-F-Ph	4-Pyr	環14	2, 2-diF
19-237	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	2, 2-diF
19-238	4-F-Ph	4-Pyr	環 16	2,2-diF
19-239	4-F-Ph	4-Pyr	環17	2,2-diF
19-240	4-F-Ph	4-Pyr	環18	2, 2-diF
19-241	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	2, 2-diF
19-242	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	2, 2-diF
19-243	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	2, 2-diF
19-244	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	2,2-diF
19-245	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	2, 2-diF
19-246	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	2, 2-diF
19-247	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	2, 2-diF
19-248	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	2,2-diF
19-249	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	2, 2-diF
19-250	4-F-Ph	4-Pyr	. 環 28	2,2-diF
19-251	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	2,2-diF
19-252	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	2, 2-diF
19-253	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	2,2-diF
19-254	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	2, 2-diF
19-255	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	2, 2-diF
19-256	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	2, 2-diF
19-257	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	2,2-diF
19-258	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	2, 2-diF
19-259	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2, 2-diF
19-260	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	8-Me
19-261	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	8-Me
19-262	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	8-Me
19-263	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	8-Me
19-264	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	8-Me
19-265	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	8-Me
19-266	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	8-Me
19-267	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	8-Me

19-268	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	8-Me
19-269	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	8-Me
19-270	4-F-Ph	4-Pyr	環 11	8-Me
19-271	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	8-Me
19-272	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	8-Me
19-273	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	8-Me
19-274	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	8-Me
19-275	4-F-Ph	4-Pyr:	環 16	8-Me
19-276	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	8-Me
19-277	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	8-Me
19-278	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	8-Me
19-279	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	8-Me
19-280	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	8-Me
19-281	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	8-Me
19-282	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	8-Me
19-283	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	8-Me
19-284	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	8-Me
19-285	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	8-Me
19-286	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	8-Me
19-287	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	8-Me
19-288	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	8-Me
19-289	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	8-Me
19-290	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	8-Me
19-291	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	8-Me
19-292	4-F <b>-P</b> h	4-Pyr	環 33	8-Me
19-293	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	. 8-Me
19-294	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	8-Me
19-295	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	8-Me
19-296	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	8-Me
19-297	4-F-Ph	$2\text{-NH}_24\text{-Pym}$	環 1	H
19-298	4-F-Ph	$2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym}$	環 2	H
19-299	4-F-Ph	$2\text{-NH}_2\text{-}4\text{-Pym}$	環 3	H
19-300	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	H
19-301	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	H
19-302	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	H
19-303	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	H

19-304	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	H
19-305	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	H
19-306	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	H
19-307	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環11	H
19-308	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	H
19-309	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	H
19-310	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	H
19-311	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	H
19-312	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	H
19-313	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環17	H
19-314	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	H
19-315	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	H
19-316	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	H
19-317	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	H
19-318	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	H
19-319	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	H
19-320	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	H
19-321	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	H
19-322	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	・ 環 26	H
19-323	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	H
19-324	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	H
19 - 325	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	H
19-326	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	H
19-327	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	H
19-328	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	H
19-329	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	H
19-330	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 34	H
19-331	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	H
19-332	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	H
19-333	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	H
19-334	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	2-Me
19-335	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2-Me
19-336	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-Me
19-337	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2-Me
19-338	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2-Me
19-339	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-Me

19-340	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2-Me
19-341	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2-Me
19-342	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2-Me
19-343	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	2-Me
19-344	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環11	2-Me
19-345	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2-Me
19-346	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 13	2-Me
19-347	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2-Me
19-348	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2-Me
19-349	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2-Me
19-350	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-Me
19-351	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-Me
19-352	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2-Me
19-353	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-Me
19-354	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-Me
19-355	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2-Me
19-356	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-Me
19-357	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-Me
19-358	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-Me
19-359	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	. 2-Me
19-360	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環.27	2-Me
19-361	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2-Me
19-362	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2-Me
19-363	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2-Me
19-364	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2-Me
19-365	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2-Me
19-366	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2-Me
19-367	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2-Me
19-368	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2-Me
19-369	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2-Me
19-370	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2-Me
19-371	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	2-0H
19-372	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2-0H
19-373	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-0H
19-374	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2-0H
19-375	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2-0H

4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環10	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環11	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環12	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2-ОН
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2-0H
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	2-Me0
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2-Me0
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-MeO
4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2-Me0
	4-F-Ph	4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 9         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 10         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 11         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 12         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 13         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 14         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 16         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 16         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 17         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 18         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 19         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 20         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 21         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 22         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 23         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 25         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 25         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 28         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 28         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 30         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 31         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym       環 32         4-F-Ph       2-NH <sub>2</sub> -4-Pym

19-412	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2-Me0
19-413	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-Me0
19-414	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2-Me0
19-415	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2-Me0
19-416	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2-Me0
19-417	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	2-MeO
19-418	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 11	2-Me0
19-419	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2-Me0
19-420	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	2-Me0
19-421	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2-Me0
19-422	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2-Me0
19-423	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2-Me0
19-424	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-MeO
19-425	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-MeO
19-426	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2-MeO
19-427	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-MeO
19-428	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-MeO
19-429	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2-MeO
19-430	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-MeO
19-431	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-Me0
19-432	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-MeO
19-433	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2-Me0
19-434	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2-Me0
19-435	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2-Me0
19-436	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2-Me0
19-437	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2-Me0
19-438	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2-Me0
19-439	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2-Me0
19-440	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2-Me0
19-441	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2-MeO
19-442	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2-Me0
19-443	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2-Me0
19-444	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2-Me0
19-445	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	2-F
19-446	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2-F
19-447	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-F
			•	

19-448	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2-F
19-449	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2-F
19-450	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-F
19-451	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2-F
19-452	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2-F
19-453	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2-F
19-454	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	2-F
19-455	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 11	2-F
19-456	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2-F
19-457	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	2-F
19-458	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2-F
19-459	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2-F
19-460	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2-F
19-461	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-F
19-462	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-F
19-463	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2-F
19-464	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-F
19-465	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-F
19-466	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2-F
19-467	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-F
19-468	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-F
19-469	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-F
19-470	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2-F
19-471	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2-F
19 - 472	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2-F
19-473	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2-F
19-474	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2-F
19-475	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2-F
19-476	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2-F
19-477	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2-F
19-478	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2-F
19-479	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2-F
19-480	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2-F
19-481	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2-F
19-482	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	2-C1
19-483	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2-C1

•				
19-484	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-C1
19-485	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2-C1
19-486	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2-C1
19-487	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-C1
19-488	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2-C1
19-489	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2-C1
19-490	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2-C1
19-491	4-F-Ph	$\sim 2-NH_2-4-Pym$	環 10	2-C1
19-492	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 11	2-C1
19-493	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2-C1
19-494	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	2-C1
19-495	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2-C1
19-496	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2-C1
19-497	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2-C1
19-498	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-C1
19-499	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-C1
19-500	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2-C1
19-501	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-C1
19-502	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-C1
19-503	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2-C1
19-504	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-C1 · ·
19-505	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-C1
19-506	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-C1
19-507	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2-C1
19-508	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2-C1
19-509	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2-C1
19-510	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2-C1
19-511	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	. 2-C1
19-512	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2-C1
19-513	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2-C1
19-514	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	. 環 33	2-C1
19-515	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2-C1
19-516	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2-C1
19-517	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2-C1
19-518	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2-C1
19-519	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	2,2-diF

19-520	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2,2-diF
19-521	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2,2-diF
19-522	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2,2-diF
19-523	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2,2-diF
19-524	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2,2-diF
19-525	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2,2-diF
19-526	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2,2-diF
19-527	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2,2-diF
19-528	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	2, 2-diF
19-529	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 11	2, 2-diF
19-530	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2, 2-diF
19-531	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	2, 2-diF
19-532	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2,2-diF
19-533	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2, 2-diF
19-534	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2,2-diF
19-535	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2, 2-diF
19-536	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2,2-diF
19-537	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2, 2-diF
19-538	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2,2-diF
19-539	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2,2-diF
19-540	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2,2-diF
19-541	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2,2-diF
19-542	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2,2-diF
19-543	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2, 2-diF
19-544	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2,2-diF
19-545	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2,2-diF
19-546	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2,2-diF
19-547	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2,2-diF
19-548	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2, 2-diF
19-549	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2, 2-diF
19-550	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2, 2-diF
19-551	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2,2-diF
19-552	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2, 2-diF
19-553	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2,2-diF
19-554	4-F-Ph	$2-\mathrm{NH_2}-4-\mathrm{Pym}$	環 36	2,2-diF
19-555	4F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2,2-diF

19-556	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 1	8-Me .
19-557	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		. 環 2	8-Me
19-558	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 3	8-Me
19-559	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 4	8-Me
19-560	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 5	8-Me .
19-561	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	: ;	環 6	8-Me
19-562	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 7	8-Me
19-563	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	環 8 :	8-Me :
19-564	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 9	8-Me
19-565	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 10	8-Me
19-566	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 11	8-Me
19-567	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 12	8-Me
19-568	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 13	8-Me
19-569	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 14	8-Me
19-570	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 15	8-Me
19-571	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 16	8-Me
19-572	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 17	8-Me
19-573	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 18	8-Me
19-574	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 19	8-Me
19-575	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 20	8-Me
19-576	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 21	8-Me
19-577	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 22	8-Me
19-578	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 23	8-Me
19-579	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 24	8-Me
19-580	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 25	8-Me
19-581	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 26	8-Me
19-582	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 27	8-Me
19-583	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 28	8-Me
19-584	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 29	8-Me
19-585	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 30	8-Me
19-586	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 31	8-Me
19-587	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 32	8-Me
19-588	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 33	8-Me
19-589	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 34	8-Me
19-590	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 35	8-Me
1,9-591	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$		環 36	8-Me

19-592	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	8-Me
19-593	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	H
19-594	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	H
19-595	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	H
19-596	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	H
19-597	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	H
19-598	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	H
19-599	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	H
19-600	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	H
19-601	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	H
19-602	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	H
19-603	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	H
19-604	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	H
19-605	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	H
19-606	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	H
19-607	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	H
19-608	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	H
19-609	4-F-Ph .	2-MeNH-4-Pym	環 17	H
19-610	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	H
19-611	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	H
19-612	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	H
19-613	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	H
19-614	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	H
19-615	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	H
19-616	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	H
19-617	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	H
19-618	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	H
19-619	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	H
19-620	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	H
19-621	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	H .
19-622	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	H
19-623	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	H
19-624	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	H
19-625	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	H
19-626	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	H
19-627	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	H

19-628	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	H
19-629	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	H
19-630	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-Me
19-631	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2 .	2-Me
19-632	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-Me .
19-633	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-Me
19-634	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-Me
19-635	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-Me
19-636	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-Me
19-637	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-Me
19-638	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2-Me
19-639	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-Me
19-640	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	2-Me
19-641	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2-Me
19-642	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-Me
19-643	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2-Me
19-644	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-Me
19-645	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2-Me
1.9-646	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-Me
19-647	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-Me
19-648	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-Me
19-649	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2-Me
19-650	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-Me
19-651	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-Me
19-652	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2-Me
19-653	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2-Me
19-654	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-Me
19-655	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-Me
19-656	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-Me
19-657	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-Me
19-658	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-Me
19-659	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2-Me
19-660	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-Me
19-661	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-Me
19-662	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2-Me
19-663	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-Me

4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-Me
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-Me
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-Me
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	2-OH
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2-0H
' 4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-OH
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2-OH
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-OH
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2-OH
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-ОН
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-0H
4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2-0H
	4-F-Ph	4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym         4-F-Ph	4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 37         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 37         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 1         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 3         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 3         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 5         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 6         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 7         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 9         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 10         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 11         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 12         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 13         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 14         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 15         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 16         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 18         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 18         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 18         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 20         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 21         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 22         4-F-Ph       2-MeNH-4-Pym       環 23

19-700	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-0H
19-701	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-0H
19-702	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-0H
19-703	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-0H
19-704	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-Me0
19-705	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2-Me0
19-706	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-Me0
19-707	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-Me0
19-708	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-Me0
19-709	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-Me0
19-710	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-Me0
19-711	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-Me0
19-712	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2-Me0
19-713	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-Me0
19-714	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	2-Me0
19-715	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2-Me0
19-716	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-Me0
19-717	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2-Me0
19-718	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-MeO
19-719	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2-Me0
19-720	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-Me0
19-721	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-Me0
19-722	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-Me0
19-723	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2-Me0
19-724	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-Me0
19-725	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-MeO
19-726	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2-Me0
19-727	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2-Me0
19-728	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-Me0
19-729	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-Me0
19-730	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-Me0
19-731	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-MeO
19-732	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-MeO
19-733	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2-MeO
19-734	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-Me0
19-735	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-MeO

19-736	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2-MeO
19-737	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-MeO
19-738	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-MeO
19-739	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-MeO
19-740	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-MeO
19-741	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-F
19-742	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2-F
19-743	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-F
19-744	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-F
19-745	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-F
19-746	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-F
19-747	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-F
19-748	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-F
19-749	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2-F
19-750	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-F
19-751	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環11	2-F
19-752	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2-F
19-753	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-F
19-754	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2-F
19-755	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-F
19-756	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2-F
19-757	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-F
19-758	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-F
19-759	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-F
19-760	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2-F
19-761	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-F
19-762	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-F
19-763	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2-F
19-764	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2-F
19-765	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-F
19-766	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-F
19-767	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-F
19-768	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-F
19-769	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-F
19-770	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2-F
19-771	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-F

19-772	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-F
19-773	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2-F
19-774	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-F
19-775	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-F
19-776	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-F
19-777	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-F
19-778	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-C1
19-779	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	, 2-Cl·.
19-780	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-C1
19-781	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-C1
19-782	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-C1
19-783	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-C1
19-784	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-C1
19-785	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-C1
19-786	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2-C1
19-787	. 4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-C1
19-788	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	2-C1
19-789	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2-C1
19-790	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-C1
19-791	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2-C1
19-792	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-C1
19-793	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2-C1
19-794	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-C1
19-795	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-C1
19-796	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-C1
19-797	4-F-Ph	2∸MeNH-4-Pym	環 20	2-C1
19-798	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-C1
19-799	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-C1
19-800	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2-C1
19-801	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2-C1
19-802	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-C1
19-803	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-C1
19-804	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-C1
19-805	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-C1
19-806	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-C1
19-807	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2-C1
19-807	4-r-r11	Z-Menn-4-Pym	块 30	

WO 03/015781 PCT/JP02/08276

19-808	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-C1
19-809	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-C1
19-810	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2-C1
19-811	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-C1
19-812	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-C1
19-813	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-C1
19-814	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-C1
19-815	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2, 2-diF
19-816	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2, 2-diF
19-817	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2, 2-diF
19-818	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2, 2-diF
19-819	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2, 2-diF
19-820	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2, 2-diF
19-821	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2, 2-diF
19-822	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2, 2-diF
19-823	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2, 2-diF
19-824	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2, 2-diF
19-825	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	2, 2-diF
19-826	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2, 2-diF
19-827	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2, 2-diF
19-828	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2, 2-diF
19-829	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2, 2-diF
19-830	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2, 2-diF
19-831	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2, 2-diF
19-832	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2, 2-diF
19-833	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2, 2-diF
19-834	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2, 2-diF
19-835	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2, 2-diF
19-836	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2, 2-diF
19-837	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2, 2-diF
19-838	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2, 2-diF
19-839	4-F-Ph .	2-MeNH-4-Pym	環 25	2, 2-diF
19-840	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2, 2-diF
19-841	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2, 2-diF
19-842	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2, 2-diF
19-843	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2, 2-diF

		•		
19-844	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2, 2-diF
19-845	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2, 2-diF
19-846	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2, 2-diF
19-847	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2, 2-diF
19-848	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2, 2-diF
19-849	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	.2, 2-diF
19-850	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2, 2-diF
19-851	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2, 2-diF
19-852	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	8-Me
19-853	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	8-Me
19-854	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	8-Me
19-855	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	8-Me
19-856	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	8-Me
19-857	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	8-Me
19-858	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	8-Me
19-859	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	8-Me
19-860	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	8-Me
19-861	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	8-Me
19-862	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	8-Me
19-863	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	8-Me
19-864	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	8-Me
19-865	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	8-Me
19-866	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	8-Me
19-867	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	8-Me
19-868	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	8-Me
19-869	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	8-Me
19-870	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	8-Me
19-871	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	8-Me
19-872	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	8-Me
19-873	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	8-Me
19-874	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	8-Me
19-875	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	8-Me
19-876	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	8-Me
19-877	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	8-Me
19-878	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	8-Me
19-879	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	8-Me

19-880	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	8-Me
19-881	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	8-Me
19-882	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	8-Me
19-883	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	8-Me
19-884	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	8-Me
19-885	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	8-Me
19-886	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	8-Me
19-887	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	8-Me
19-888	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	8-Me
19-889	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 1	H
19-890	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 2	H
19-891	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 3	H
19-892	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	. 環 4	H
19-893	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 5	H
19-894	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 6	H
19-895	4-F-Ph	$2-$ ( $\alpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 7	H
19-896	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 8	H
19-897	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 9	H
19-898	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環10	H
19-899	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環11	H
19-900	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 12	H
19-901	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 13	H
19-902	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 14	H
19-903	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 15	H
19-904	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環16	H
19-905	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 17	H
19-906	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 18	H
19-907	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 19	H
19-908	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	H
19-909	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 21	. Н
19-910	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 22	H
19-911	4-F-Ph	$2-$ ( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 23	H
19-912	4-F-Ph	$2-$ ( $\alpha$ -Me-BnNH) $-$ 4-Pym	環 24	H
19-913	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 25	H
19-914	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 26	H
19-915	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 27	H

19-916	4-F-Ph .	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	Н
19-917	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 29	H ·
19-918	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 30	<b>H</b>
19-919	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 31	Н
19-920	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 32	. Н
19-921	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 33	H.
19-922	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	H
19-923	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 35	: Н
19-924	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 36	H
19-925	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 37	H
19-926	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 1	2-Me
19-927	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	2-Me
19-928	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 3	2-Me
19-929	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 4	2-Me
19-930	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 5	2-Me
19-931	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 6	2-Me
19-932	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 7	2-Me
19-933	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 8	2-Me
19-934	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 9	2-Me
19-935	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	2-Me
1:9-936	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環11	2-Me
19-937	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 12	2-Me
19-938	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 13	2-Me
19-939	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環14	2-Me
19-940	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 15	2-Me
19-941	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環16	2-Me
19-942	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環17	2-Me
19-943	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 18	2-Me
19-944	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 19	2-Me
19-945	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	2-Me
19-946	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 21	2-Me
19-947	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 22	2-Me
19-948	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 23	2-Me
19-949	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 24	2-Me
19-950	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 25	2-Me
19-951	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 26	2-Me

19-952	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 27	2-Me
19-953	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 28	2-Me
19-954	4-F¬Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 29	2-Me
19-955	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 30	2-Me
19-956	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 31	2-Me
19-957	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 32	2-Me
19-958	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 33	2-Me
19-959	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 34	2-Me
19-960	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 35	2-Me
19-961	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 36	2-Me
19-962	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 37	2-Me
19-963	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 1	2-0H
19-964	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 2	2-0H .
19-965	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 3	2-0H
19-966	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 4	2-0H
19-967	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 5	2-0H
19-968	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 6	2-0H
19-969	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 7	2-0H
19-970	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 8	2-0H
19-971	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 9	2-0H
19-972	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環10	2-0H
19-973	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環11	2-0H
19-974	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 12	2-0H
19-975	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環13	2-0H
19-976	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-$ 4-Pym	環 14	2-0H
19-977	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 15	2-0H
19-978	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環16	2-0H
19-979	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 17	2-0H
19-980	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 18	2-0H
19-981	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 19	2-OH
19-982	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 20	2-0H
19-983	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 21	2-0H
19-984	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 22	2-0H
19-985	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 23	2-0H
19-986	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 24	2-0H
19-987	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 25	2-0H

19-988	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 26	2-0H
19-989	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 27	2-0H
19-990	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	2-0H
19-991	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 29	2-0H
19-992	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 30	2-0H
1:9-993	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 31	2-0H
19-994	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 32	2-0H
19-995	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 33	2-0H
19-996	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	2-0H
19-997	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 35	2-0H
19-998	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 36	2-0H
19-999	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 37	2-0H
19-1000	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 1	2-MeO
19-1001	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-$ 4-Pym	環 2	2-Me0
19-1002	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 3	2-Me0
19-1003	4-F-Ph	$2-(\alpha-\text{Me-BnNH})-4-\text{Pym}$	環 4	2-MeO
19-1004	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 5	2-Me0
19-1005	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 6	2-MeO
19-1006	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 7	2-Me0
19-1007	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 8	2-MeO
19-1008	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 9	2-MeO
19-1009	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	2-MeO
19-1010	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環11	2-MeO
19-1011	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 12	2-MeO
19-1012	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4$ -Pym	環 13	2-MeO
19-1013	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 14	2-MeO
19-1014	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 15	2-MeO
19-1015	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 16	2-MeO
19-1016	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 17	2-Me0
19-1017	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 18	2-Me0
19-1018	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 19	2-Me0
19-1019	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	2-Me0
19-1020	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 21	2-MeO
19-1021	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 22	2-MeO
19-1022	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	2-Me0
19-1023	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 24	2-MeO

19-1024	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 25	2-Me0
19-1025	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 26	2-Me0
19-1026	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 27	2-Me0
19-1027	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 28	2-Me0
19-1028	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 29	2-Me0
19-1029	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 30	2-Me0
19-1030	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 31	2-Me0
19-1031	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 32	2-Me0
19-1032	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 33	2-MeO
19-1033	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	2-Me0
19-1034	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 35	2-Me0
19-1035	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 36	2-Me0
19-1036	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 37	2-Me0
19-1037	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 1	2-F
19-1038	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	2-F
19-1039	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 3	2-F
19-1040	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 4	2-F
19-1041	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 5	2-F
19-1042	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 6	2-F
19-1043	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 7	2-F
19-1044	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 8	2-F
19-1045	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-$ 4-Pym	環 9	2-F
19-1046	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 10	2-F
19-1047	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環11	2-F
19-1048	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 12	2-F
19-1049	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 13	2-F
19-1050	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 14	2-F
19-1051	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 15	2-F
19-1052	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-$ 4-Pym	環 16	2-F
19-1053	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-$ 4-Pym	環 17	2-F
19-1054	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 18	2-F
19-1055	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 19	2-F
19-1056	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 20	2-F
19-1057	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 21	2-F
19-1058	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 22	2-F
19-1059	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	2-F

19-1060	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 24	2-F
19-1061	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 25	2-F
19-1062	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 26	2-F
19-1063	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 27	2-F
19-1064	4-F-Ph.	2-(α-Me-BnNḤ)-4-Pym	環 28	2-F
19-1065	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 29	2-F
19-1066	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 30	2-F
19-1067	4-F-Ph -	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 31	. 2-F
19-1068	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 32	2-F
19-1069	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 33	2-F
19-1070	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 34	2-F
19-1071	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 35	2-F
19-1072	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 36	2-F
19-1073	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 37	2-F
19-1074	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 1	2-C1
19-1075	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 2	2-C1
19-1076	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 3	2-C1
19-1077	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-$ 4-Pym	環 4	2-C1
19-1078	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 5	2-C1
19-1079	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-$ 4-Pym	環 6	2-C1
19-1080	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 7	2-C1
19-1081	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 8	2-C1
19-1082	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 9	2-C1
19-1083	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-$ 4-Pym	環 10	2-C1
19-1084	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 11	2-C1
19-1085	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 12	2-C1
19-1086	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 13	2-C1
19-1087	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 14	2-C1
19-1088	4-F-Ph	$2-(\alphaMe-BnNH)-4-Pym$	環 15	2-C1
19-1089	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 16	2-C1
19-1090	4-F-Ph	$^{\circ}$ 2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環17	2-C1
19-1091	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 18	2-C1
19-1092	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 19	2-C1
19-1093	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 20	2-C1
19-1094	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 21	2-C1
19-1095	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 22	2-C1

19-1096	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	2-C1
19-1097	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 24	2-C1
19-1098	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 25	2-C1
19-1099	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 26	2-C1
19-1100	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 27	2-C1
19-1101	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 28	2-C1
19-1102	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 29	2-C1
19-1103	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 30	2-C1
19-1104	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 31	2-C1
19-1105	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 32	2-C1
19-1106	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 33	2-C1
19-1107	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	2-C1
19-1108	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 35	2-C1
19-1109	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 36	2-C1
19-1110	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 37	2-C1
19-1111	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 1	2, 2-diF
19-1112	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	2, 2-diF
19-1113	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 3	2,2-diF
19-1114	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 4	2,2-diF
19-1115	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 5	2, 2-diF
19-1116	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 6	2, 2-diF
19-1117	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 7	2, 2-diF
19-1118	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 8	2, 2-diF
19-1119	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 9	2, 2-diF
19-1120	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	2, 2-diF
19-1121	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 11	2, 2-diF
19-1122	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 12	2, 2-diF
19-1123	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 13	2, 2-diF
19-1124	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 14	2, 2-diF
19-1125	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 15	2, 2-diF
19-1126	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 16	2, 2-diF
19-1127	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 17	2, 2-diF
19-1128	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 18	2, 2-diF
19-1129	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 19	2, 2-diF
19-1130	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	2, 2-diF
19-1131	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 21	2, 2-diF

WO 03/015781 PCT/JP02/08276

269

19-1132	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 22	2, 2-diF
19-1133	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	2,2-diF
19-1134	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 24	2, 2-diF
19-1135	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 25	2, 2-diF
19-1136	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 26	2, 2-diF
19-1137	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 27	2,2-diF
19-1138	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	2,2-diF
19-1139	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 29	2, 2-diF
19-1140	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 30	2, 2-diF
19-1141	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 31	2, 2-diF
19-1142	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 32	2, 2-diF
19-1143	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 33	2, 2-diF
19-1144	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 34	2, 2-diF
19-1145	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 35	2, 2-diF
19-1146	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 36	2, 2-diF
19-1147	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 37	2, 2-diF
19-1148	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 1	8-Me
19-1149	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	8-Me
19-1150	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 3	8-Me
·19-1151	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 4	8-Me
19-1152	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 5	8-Me
19-1153	4-F-Pḥ	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 6	8-Me
19-1154	4−F−Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 7	8-Me
19-1155	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 8	8-Me
19-1156	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 9	8-Me
19-1157	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	8-Me
19-1158	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環11	8-Me
19-1159	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 12	8-Me
19-1160	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 13	8-Me
19-1161	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 14	8-Me
19-1162	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 15	8-Me
19-1163	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 16	8-Me
19-1164	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 17	8-Me
19-1165	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 18	8-Me
19-1166	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 19	8-Me
19-1167	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 20	8-Me

19-1168	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 21	8-Me
19-1169	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 22	8-Me
19-1170	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	8-Me
19-1171	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 24	8-Me
19-1172	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 25	8-Me
19-1173	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 26	8-Me
19-1174	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 27	8-Me
19-1175	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	8-Me
19-1176	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 29	8-Me
19-1177	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 30	8-Me
19-1178	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 31	8-Me
19-1179	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 32	8-Me
19-1180	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 33	8-Me
19-1181	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	8-Me
19-1182	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 35	8-Me
19-1183	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 36	8-Me
19-1184	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 37	8-Me

化合物 番 号	R <sup>1</sup>	R²	. A R <sup>\$</sup>
20-1	4-F-Ph	4-Pyr	環 1 H
20-2	4-F-Ph	4-Pyr	環 2 H
20-3	4-F-Ph	4-Pyr	環 3 H
20-4	4-F-Ph	4-Pyr	環 4 H
20-5	4-F-Ph	4-Pyr	環 5 H
20-6	4-F-Ph	4-Pyr	環 6 H

20-7	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	H
20-8	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	H
20-9	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	H
20-10	4-F-Ph	4-Pyr	環10	H
20-11	4-F-Ph	4-Pyr	環 11	H
20-12	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	H
20-13	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	H
20-14	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	H
20-15	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	H
20-16	4-F-Ph	4-Pyr	環16	H
20-17	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	H
20-18	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	H
20-19	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	H
20-20	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	H
20-21	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	H
20-22	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	H
20-23	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	H
20-24	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	H
20-25	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	H
20-26	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	H
20-27	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	H
20-28	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	H
20-29	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	H
20-30	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	H
20-31	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	H
20-32	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	H
20-33	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	H
20-34	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	H
20-35	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	H
20-36	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	H
20-37	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	H
20-38	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	2-Me
20-39	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	2-Me
20-40	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	2-Me
20-41	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	2-Me
20-42	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	2-Me

20-43	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	2-Me
20-44	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	2-Me
20-45	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	2-Me
20-46	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	2-Me
20-47	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	2-Me
20-48	4-F-Ph	4-Pyr	環11	2-Me
20-49	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	2-Me
20-50	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	2-Me
20-51	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	2-Me
20-52	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	2-Me
20-53	4-F-Ph	4-Pyr	環 16	2-Me
20-54	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	2-Me
20-55	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	2-Me
20-56	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	2-Me
20-57	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	2-Me
20-58	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	2-Me
20-59	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	2-Me
20-60	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	2-Me
20-61	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	2-Me
20-62	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	2-Me
20-63	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	2-Me
20-64	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	2-Me
20-65	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	2-Me
20-66	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	2-Me
20-67	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	2-Me
20-68	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	2-Me
20-69	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	2-Me
20-70	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	2-Me
20-71	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	2-Me
20-72	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	2-Me
20-73	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	2-Me
20-74	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2-Me
20-75	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	2-0H
20-76	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	2-0H
20-77	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	2-0H
20-78	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	2-0H

20-79	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	2-0H
20-80	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	2-0H
20-81	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	2-0H
20-82	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	2-0H
20-83	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	2-0H
20-84	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	2-0H
20-85	4-F-Ph	4-Pyr	環 11	2-0H
20-86	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	2-0H
20-87	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	2-0H
20-88	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	2-0H
20-89	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	2-0H
20-90	4-F-Ph	4-Pyr	環 16	2-0H
20-91	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	2-0H
20-92	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	2-0H
20-93	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	2-OH
20-94	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	2-0H
20-95	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	2-0H
20-96	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	2-OH
20-97	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	2-0H
20-98	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	2-0H
20-99	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	2-0H
20-100	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	2-0H
20-101	4-F-Ph	4-Pyr.	環 27	2-0H
20-102	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	2-0H
20-103	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	2-0H
20-104	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	2-0H
20-105	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	2-0H
20-106	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	2-0H
20-107	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	2-0H
20-108	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	2-0H
20-109	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	2-0H
20-110	4-F-Ph	4-Pyr	環,36	2-0H
20-111	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2-0H
20-112	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	2-Me0
20-113	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	2-Me0
20-114	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	2-Me0

,

20-115	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	2-Me0
20-116	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	2-Me0
20-117	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	2-Me0
20-118	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	2-Me0
20-119	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	2-Me0
20-120	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	2-Me0
20-121	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	2-Me0
20-122	4-F-Ph	4-Pyr	環11	2-Me0
20-123	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	2-Me0
20-124	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	2-MeO
20-125	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	2-MeO
20-126	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	2-Me0
20-127	4-F-Ph	4-Pyr	環 16	2-Me0
20-128	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	2-MeO
20-129	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	2-MeO
20-130	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	2-MeO
20-131	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	2-Me0
20-132	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	2-Me0
20-133	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	2-MeO
20-134	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	2-MeO
20-135	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	2-Me0
20-136	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	2-MeO
20-137	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	2-MeO
20-138	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	2-MeO
20-139	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	2-Me0
20-140	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	2-MeO
20-141	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	2-MeO
20-142	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	2-MeO
20-143	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	2-MeO
20-144	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	2-MeO
20-145	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	2-MeO
20-146	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	2-MeO
20-147	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	2-Me0
20-148	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2-MeO
20-149	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	2-F
20-150	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	2-F

•					
20-151	4-F-Ph	4-Pyr		環 3	2-F
20-152	4-F-Ph	4-Pyr		環 4	2-F
20-153	4-F-Ph	4-Pyr		環 5	2-F
20-154	4-F-Ph	4-Pyr		環 6	2-F
20-155	4-F-Ph	4-Pyr	•	環 7	2-F
20-156	4-F-Ph	4-Pyr		環 8	2-F
20-157	4-F-Ph	4-Pyr		環 9	2-F
20-158	4-F-Ph	4-Pyr	•	環10	. 2-F
20-159	4-F-Ph	4-Pyr		環11	2-F
20-160	4-F-Ph	4-Pyr		環 12	2-F
20-161	4-F-Ph	4-Pyr		環 13	2-F
20-162	4-F-Ph	4-Pyr		環 14	2-F
20-163	4-F-Ph	4-Pyr		環 15	2-F
20-164	4-F-Ph	4-Pyr		環 16	2-F
20-165	4-F-Ph	4-Pyr		環 17	2-F
20-166	4-F-Ph	4-Pyr		環 18	2-F
20-167	4-F-Ph	4-Pyr		環 19	2-F
20-168	4-F-Ph	4-Pyr		環 20	2-F
20-169	4-F-Ph	4-Pyr		環 21	2-F
20-170	4-F-Ph	4-Pyr		環 22	2-F
20-171	4-F-Ph '	4-Pyr		環 23	· 2-F
20-172	4-F-Ph	4-Pyr		環 24	2-F
20-173	4-F-Ph	4-Pyr		環 25	2-F
20-174	4-F-Ph	4-Pyr		環 26	2-F
20-175	4-F-Ph	4-Pyr		環 27	2-F
20-176	4-F-Ph	4-Pyr		環 28	2-F
20-177	4-F-Ph	4-Pyr		環 29	2-F
20-178	4-F-Ph	4-Pyr		環 30	2-F
20-179	4-F-Ph	4-Pyr		環 31	2-F
20-180	4-F-Ph	4-Pyr		環 32	2-F
20-181	4-F-Ph	4-Pyr		環 33	2-F
20-182	4-F-Ph	4-Pyr		環 34	2-F
20-183	4-F-Ph	4-Pyr		環 35	2-F
20-184	4-F-Ph	4-Pyr		環 36	2-F
20-185	4-F-Ph	4-Pyr		環 37	2-F
20-186	4-F-Ph	4-Pyr		環 1	2-C1

20-187	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	2-C1
20-188	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	2-C1
20-189	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	2-C1
20-190	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	2-C1
20-191	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	2-C1
20-192	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	2-C1
20-193	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	2-C1
20-194	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	2-C1
20-195	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	2-C1
20-196	4-F-Ph	4-Pyr	環11	2-C1
20-197	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	2-C1
20-198	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	2-C1
20-199	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	2-C1
20-200	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	2-C1
20-201	4-F-Ph	4-Pyr	環 16	2-C1
20-202	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	2-C1
20-203	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	2-C1
20-204	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	2-C1
20-205	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	2-C1
20-206	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	2-C1
20-207	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	2-C1
20-208	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	2-C1
20-209	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	2-C1
20-210	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	2-C1
20-211	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	2-C1
20-212	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	2-C1
20-213	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	2-C1
20-214	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	2-C1
20-215	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	2-C1
20-216	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	2-C1
20-217	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	2-C1
20-218	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	2-C1
20-219	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	2-C1
20-220	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	2-C1
20-221	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	2-C1
20-222	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2-C1

WO 03/015781 PCT/JP02/08276

20-223	4-F-Ph	4-Pyr		環 1	2, 2-diF
20-224	4-F-Ph	4-Pyr		環 2	2, 2-diF
20-225	4-F-Ph	4-Pyr		環 3	2, 2-diF
20-226	4-F-Ph	4-Pyr		環 4	2, 2-diF
20-227	4-F-Ph	4-Pyr		環 5	2, 2-diF
20-228	4-F-Ph	4-Pyr		環 6	2, 2-diF
20-229	4-F-Ph	4-Pyr		環 7	2, 2-diF
20-230	4-F-Ph .	4-Pyr	• .	環 8	2, 2-diF
20-231	4-F-Ph	4-Pyr		環 9	2,2-diF
20-232	4-F-Ph	4-Pyr		環10	2, 2-diF
20-233	4-F-Ph	4-Pyr		環 11	2,2-diF
20-234	4-F-Ph	4-Pyr		環 12	2,2-diF
20-235	4-F-Ph	4-Pyr		環 13	2, 2-diF
20-236	4-F-Ph	4-Pyr		環 14	2, 2-d i F
20-237	4-F-Ph	4-Pyr		環 15	
20-238	4-F-Ph	4-Pyr		環 16	2, 2-d i F
20-239	4-F-Ph	4-Pyr		環 17	2, 2-diF
20-240	4-F-Ph	4-Pyr		環18	2, 2-diF
20-241	4-F-Ph	4-Pyr		環 19	2, 2-diF
20-242	4-F-Ph	4-Pyr		環 20	2, 2-diF
20-243	4-F-Ph	4-Pyr	•	環 21	2, 2-diF
20-244	4-F-Ph	4-Pyr		環 22	2,2-diF
20-245	4-F-Ph	4-Pyr		環 23	2,2-diF
20-246	4-F-Ph	4-Pyr		環 24	2, 2-diF
20-247	4-F-Ph	4-Pyr		環 25	2, 2-diF
20-248	4-F-Ph	4-Pyr		環 26	2, 2-diF
20-249	4-F-Ph	4-Pyr		環 27	2, 2-diF
20-250	4-F-Ph	4-Pyr		環 28	2, 2-diF
20-251	4-F-Ph	4-Pyr		環 29	2, 2-diF
20-252	4-F-Ph	4-Pyr		環 30	2, 2-diF
20-253	4-F-Ph	4-Pyr		環 31	2, 2-diF
20-254	4-F-Ph	4-Pyr		環 32	2, 2-diF
20-255	4-F-Ph	4-Pyr		環 33	2, 2-diF
20-256	4-F-Ph	4-Pyr		環 34	
20-257	4-F-Ph	4-Pyr		環 35	2, 2-diF
20-258	4-F-Ph	4-Pyr		環 36	2, 2-diF

20-259	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	2,2-diF
20-260	4-F-Ph	4-Pyr	環 1	8-Me
20-261	4-F-Ph	4-Pyr	環 2	8-Me
20-262	4-F-Ph	4-Pyr	環 3	8-Me
20-263	4-F-Ph	4-Pyr	環 4	8-Me
20-264	4-F-Ph	4-Pyr	環 5	8-Me
20-265	4-F-Ph	4-Pyr	環 6	8-Me
20-266	4-F-Ph	4-Pyr	環 7	8-Me
20-267	4-F-Ph	4-Pyr	環 8	8-Me
20-268	4-F-Ph	4-Pyr	環 9	8-Me
20-269	4-F-Ph	4-Pyr	環 10	8-Me
20-270	4-F-Ph	4-Pyr	環 11	, 8-Me
20-271	4-F-Ph	4-Pyr	環 12	8-Me
20-272	4-F-Ph	4-Pyr	環 13	8-Me
20-273	4-F-Ph	4-Pyr	環 14	8-Me
20-274	4-F-Ph	4-Pyr	環 15	8-Me
20-275	4-F-Ph	4-Pyr	環 16	8-Me
20-276	4-F-Ph	4-Pyr	環 17	8-Me
20-277	4-F-Ph	4-Pyr	環 18	8-Me
20-278	4-F-Ph	4-Pyr	環 19	8-Me
20-279	4-F-Ph	4-Pyr	環 20	8-Me
20-280	4-F-Ph	4-Pyr	環 21	8-Me
20-281	4-F-Ph	4-Pyr	環 22	8-Me
20-282	4-F-Ph	4-Pyr	環 23	8-Me
20-283	4-F-Ph	4-Pyr	環 24	8-Me
20-284	4-F-Ph	4-Pyr	環 25	8-Me
20-285	4-F-Ph	4-Pyr	環 26	8-Me
20-286	4-F-Ph	4-Pyr	環 27	8-Me
20-287	4-F-Ph	4-Pyr	環 28	8-Me
20-288	4-F-Ph	4-Pyr	環 29	8-Me
20-289	4-F-Ph	4-Pyr	環 30	8-Me
20-290	4-F-Ph	4-Pyr	環 31	8-Me
20-291	4-F-Ph	4-Pyr	環 32	8-Me
20-292	4-F-Ph	4-Pyr	環 33	8-Me
20-293	4-F-Ph	4-Pyr	環 34	8-Me
20-294	4-F-Ph	4-Pyr	環 35	8-Me

20-295	4-F-Ph	4-Pyr	環 36	8-Me
20-296	4-F-Ph	4-Pyr	環 37	8-Me
20-297	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	H
20-298	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	H
20-299	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	H
20-300	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	H
20-301	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	H
20-302	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	H
20-303	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	H
20-304	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	H
20-305	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	H
20-306	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	H
20-307	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 11	H
20-308	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	H
20-309	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	Н .
20-310	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	H
20-311	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	H
20-312	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	H
20-313	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	H
20-314	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 18	H
20-315	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	H
20-316	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	H
20-317	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	H
20-318	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 22	H
20-319	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	H
20-320	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	H
20-321	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	H
20-322	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	H
20-323	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	H
20-324	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	H
20-325	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	H
20-326	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	H
20-327	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	H
20-328	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	H
20-329	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	H
20-330	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	H

20-331	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	H
20-332	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	H
20-333	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	H
20-334	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	2-Me
20-335	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2-Me
20-336	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-Me
20-337	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2-Me
20-338	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2-Me
20-339	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-Me
20-340	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2-Me
20-341	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2-Me
20-342	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2-Me
20-343	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	2-Me
20-344	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 11	2-Me
20-345	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2-Me
20-346	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	2-Me
20-347	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2-Me
20-348	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2-Me
20-349	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2-Me
20-350	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-Me
20-351	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-Me
20-352	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2-Me
20-353	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-Me
20-354	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-Me
20-355	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2-Me
20 - 356	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-Me
20-357	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-Me
20-358	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-Me
20-359	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2-Me
20-360	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2-Me
20-361	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2-Me
20-362	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	
20-363	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	
20-364	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2-Me
20-365	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2-Me
20-366	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2-Me

20-367	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2-Me
20-368	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2-Me
20-369	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2-Me
20-370	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2-Me
20-371	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	2-0H
20-372	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2-0H
20-373	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-0H
20-374	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2-0H
20-375	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2-0H
20-376	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-OH
20-377	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2-0H
20-378	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2-0H
20-379	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2-0H
20-380	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	2-0H
20-381	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環11	2-0H
20-382	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2-0H
20-383	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	2-0H
20-384	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2-0H
20-385	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2-0H
20-386	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2-0H
20-387	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-0H
20-388	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-0H
20-389	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2-0H
20-390	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-0H
20-391	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-0H
20-392	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2-0H
20-393	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-0H
20-394	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-0H
20-395	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-0H
20-396	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2-0H
20-397	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2-0H
20-398	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2-0H
20-399	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2-0H
20-400	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2-0H
20-401	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2-0H
20-402	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2-0H

20-403	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 33	2-0H
20-404	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2-0H
20-405	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2-0H
20-406	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2-0H
20-407	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2-0H
20-408	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	2-Me0
20-409	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2-Me0
20-410	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-Me0
20-411	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2-Me0
20-412	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2-Me0
20-413	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-Me0
20-414	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2-Me0
20-415	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2-Me0
20-416	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2-MeO
20-417	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	2-Me0
20-418	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 11	2-Me0
20-419	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2-Me0
20-420	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	2-Me0
20-421	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2-MeO
20-422	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2-MeO
20-423	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2-MeO
20-424	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-Me0
20-425	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-MeO
20-426	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2-MeO
20-427	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-MeO
20-428	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-MeO
20-429	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2-MeO
20-430	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-MeO
20-431	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-Me0
20-432	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-Me0
20-433	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2-MeO
20-434	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2-Me0
20-435	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2-MeO
20-436	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2-Me0
20-437	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2-Me0
20-438	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2-MeO

20-439	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2-Me0
20-440	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2-MeO
20-441	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 34	2-MeO
20-442	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2-MeO
20-443	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2-Me0
20-444	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2-MeO
20-445	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	2-F
20-446	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pým	環 2	2-F
20-447	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-F
20-448	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2-F
20-449	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2-F
20-450	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-F
20-451	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2-F
20-452	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2-F
20-453	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2-F
20-454	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	2-F
20-455	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 11	2-F
20-456	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 12	2-F
20-457	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	2-F
20-458	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2-F
20-459	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2-F
20-460	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2-F
20-461	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-F
20-462	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-F
20-463	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2-F
20-464	. 4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-F
20-465	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-F
20-466	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2-F
20-467	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-F
20-468	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-F
20-469	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-F
20-470	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	2-F
20-471	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	2-F
20-472	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	2-F
20-473	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 29	2-F
20-474	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2-F

20-475	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2-F
20-476	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2-F
20-477	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2-F
20-478	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2-F
20-479	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2-F
20-480	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2-F
20-481	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2-F
20-482	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	2-C1
20-483	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2-C1
20-484	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2-C1
20-485	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	2-C1
20-486	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 5	2-C1
20-487	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	2-C1
20-488	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2-C1
20-489	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 8	2-C1
20-490	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2-C1
20-491	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	2-C1
20-492	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環11	2-C1
20-493	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 12	2-C1
20-494	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	2-C1
20-495	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	2-C1
20-496	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	2-C1
20-497	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	2-C1
20-498	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2-C1
20-499	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2-C1
· 20 <b>-</b> 500.	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	2-C1
20-501	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2-C1
20-502	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	2-C1
20-503	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	2-C1
20-504	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	2-C1
20-505	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	2-C1
20-506	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2-C1
20-507	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 26	2-C1
20-508	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 27	2-C1
20-509	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 28	2-01
20-510	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2-C1

20-511	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2-C1
20-512	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2-C1
20-513	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 32	2-C1
20-514	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2-C1
20-515	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 34	2-C1
20-516	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2-C1
20-517	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2-C1
20-518	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 37	2-C1
20-519	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 1	2,2-diF
20-520	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	2,2-diF
20-521	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	2,2-diF
20-522	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 4	2,2-diF
20-523	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 5	2, 2-diF
20-524	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 6	2, 2-diF
20-525	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	2,2-diF
20-526	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 8	2,2-diF
20-527	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	2, 2-diF
20-528	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環10	2,2-diF
20-529	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環11	2, 2-diF
20-530	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環12	2,2-diF
20-531	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環13	2,2-diF
20-532	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環14	2,2-diF
20-533	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 15	2, 2-diF
20-534	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 16	2, 2-diF
20-535	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	2, 2-diF
20-536	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	2, 2-diF
20-537	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 19	2,2-diF
20-538	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	2, 2-diF
20-539	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 21	2, 2-diF
20-540	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 22	2, 2-diF
20-541	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 23	2, 2-diF
20-542	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 24	2, 2-diF
20-543	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	2, 2-d i F
20-544	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 26	2, 2-diF
20-545	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 27	2, 2-diF
20-546	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 28	2, 2-diF

20-547	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	2, 2-diF
20-548	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	2, 2-diF
20-549	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	2, 2-diF
20-550	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	2, 2-d i F
20-551	4F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	2, 2-diF
20-552	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	2, 2-diF
20-553	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	2, 2-diF
20-554	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	2,2-diF
20-555	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	2, 2-diF
20-556	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 1	8-Me
20-557	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 2	8-Me
20-558	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 3	8-Me
20-559	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 4	8-Me
20-560	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 5	8-Me
20-561	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 6	8-Me
20-562	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 7	8-Me
20-563	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 8	8-Me
20-564	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 9	8-Me
20-565	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 10	8-Me
20-566	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 11	8-Me
20-567	4-F-Ph	2-NH <sub>2</sub> -4-Pym	環 12	8-Me
20-568	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 13	8-Me
20-569	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 14	8-Me
20-570	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 15	8-Me
20-571	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 16	8-Me
20-572	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 17	8-Me
20-573	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 18	8-Me
20-574	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 19	8-Me
20-575	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 20	8-Me
20-576	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 21	8-Me
20-577	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 22	8-Me
20-578	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 23	8-Me
20-579	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 24	8-Me
20-580	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 25	8-Me
20-581	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 26	8-Me
20-582	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 27	8-Me

WO 03/015781 PCT/JP02/08276

20-583	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 28	8-Me
20-584	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 29	8-Me
20-585	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 30	8-Me
20-586	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 31	8-Me
20-587	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 32	8-Me
20-588	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 33	8-Me
20-589	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 34	8-Me
20-590	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 35	8-Me
20-591	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 36	8-Me
20-592	4-F-Ph	$2-NH_2-4-Pym$	環 37	8-Me
20-593	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	H
20-594	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	H
20-595	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	H
20-596	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	H
20-597	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	H
20-598	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	H
20-599	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	H
20-600	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	H
2.0-601	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	H
20-602	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	H
20-603	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環11	H
20-604	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	H
20-605	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	H
20-606	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	H
20-607	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	H
20-608	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環16	H
20-609	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	H
20-610	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	H
20-611	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	H
20-612	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	H
20-613	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	, <b>H</b>
20-614	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	H
20-615	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	H
20-616	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	H
20-617	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	H
20-618	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	H

20-619	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	Н
20-620	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	H
20-621	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	H
20-622	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	H
20-623	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	H
20-624	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	H
20-625	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	H
20-626	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	H
20-627	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	H
20-628	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	H
20-629	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	H
20-630	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-Me
20-631	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2-Me
20-632	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-Me
20-633	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-Me
20-634	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-Me
20-635	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-Me
20-636	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-Me
20-637	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-Me
20-638	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2-Me
20-639	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-Me
20-640	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	2-Me
20-641	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2-Me
20-642	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-Me
20-643	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2-Me
20-644	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-Me
20-645	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2-Me
20-646	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-Me
20-647	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-Me
20-648	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-Me
20-649	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2-Me
20-650	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-Me
20-651	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-Me
20-652	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2-Me
20-653	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2-Me
20-654	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-Me

20-655	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-Me
20-656	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-Me
20-657	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-Me
20-658	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-Me
20-659	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30 "	2-Me
20-660	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-Me
20-661	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-Me
20-662	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2-Me
20-663	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-Me
20-664	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-Me
20-665	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-Me
20-666	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-Me
20-667	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-0H
20-668	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2-0H
20-669	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-0H
20-670	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-0H
20-671	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-0H
20-672	4-F-Ph "	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-0H
20-673	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-0H
20-674	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-0H
20-675	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2-0H
20-676	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-0H
20-677	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	2-0H
20-678	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2-0H
20-679	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-0H
20-680	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2-0H
20-681	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-0H
20-682	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2-0H
20-683	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-0H
20-684	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-0H
20-685	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-0H
20-686	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2-0H
20-687	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-0H
20-688	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-0H
20-689	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2-0H
20-690	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2-0H

20-691	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-0H
20-692	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-0H
20-693	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-0H
20-694	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-0H
20-695	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-0H
20-696	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2-0H
20-697	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-0H
20-698	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-0H
20-699	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2-0H
20-700	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-0H
20-701	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-0H
20-702	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-0H
20-703	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-0H
20-704	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-MeO
20-705	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2-MeO
20-706	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-MeO
20-707	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-MeO
20-708	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-MeO
20-709	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-MeO
20-710	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-MeO
20-711	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-MeO
20-712	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2-MeO
20-713	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-Me0
20-714	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	2-Me0
20-715	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2-Me0
20-716	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-Me0
20-717	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2-MeO
20-718	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-Me0
20-719	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2-Me0
20-720	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-Me0
20-721	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-Me0
20-722	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-Me0
20-723	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2-Me0
20-724	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-Me0
20-725	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-Me0
20-726	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2-MeO

20-727	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2-Me0
20-728	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-Me0
20-729	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-MeO
20-730	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-Me0
20-731	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-Me0
20-732	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-MeO
20-733	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2-Me0
20-734	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-Me0
20-735	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-MeO
20-736	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	. 環 33	2-MeO
20-737	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-Me0
20-738	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-Me0
20-739	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-Me0
20-740	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-MeO
20-741	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-F
20-742	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2-F
20-743	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-F
20-744	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-F
20-745	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-F
20-746	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-F
20-747	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-F
20-748	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-F
20-749	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2-F
20-750	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-F
20-751	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	2-F
20-752	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2-F
20-753	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-F
20-754	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2-F
20-755	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-F
20-756	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環16	2-F ·
20-757	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-F
20-758	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-F
20-759	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-F
20-760	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2-F
20-761	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-F
20-762	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-F

20-763	. 4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2-F
20-764	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	- 環 24	2-F
20-765	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-F
20-766	4F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-F
20-767	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-F
20-768	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-F
20-769	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-F
20-770	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2-F
20-771	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-F
20-772	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-F
20-773	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2-F
20-774	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-F
20-775	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-F
20-776	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-F
20-777	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-F
20-778	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2-C1
20-779	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2-C1
20-780	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2-C1
20-781	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	2-C1
20-782	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2-C1
20-783	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2-C1
20-784	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2-C1
20-785	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2-C1
20-786	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	. 環 9	2-C1
20-787	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2-C1
20-788	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 11	2-C1
20-789	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2-C1
20-790	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 13	2-C1
20-791	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2-C1
20-792	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2-C1
20-793	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2-C1
20-794	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2-C1
20-795	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2-C1
20-796	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2-C1
20-797	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2-C1
20-798	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2-C1

20-799	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2-C1
20-800	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2-C1
20-801	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2-C1
20-802	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2-C1
20-803	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2-C1
20-804	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2-C1
20-805	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2-C1
20-806	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2-C1
20-807	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2-C1
20-808	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2-C1
20-809	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2-C1
20-810	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2-C1
20-811	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2-C1
20-812	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2-C1
20-813	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2-C1
20-814	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2-C1
20-815	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	2,2-diF
20-816	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	2,2-diF
20-817	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	2,2-diF
20-818	4-F-Ph.	2-MeNH-4-Pym	.環.4	2,2-diF
20-819	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	2,2-diF
20-820	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	2,2-diF
20-821	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	2,2-diF
20-822	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	2,2-diF
20-823	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	2, 2-diF
20-824	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	2,2-diF
20-825	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環11	2,2-diF
20-826	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	2,2-diF
20-827	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環13	2,2-diF
20-828	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	2,2-diF
20-829	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	2,2-diF
20 -830	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	2,2-diF
20 -831	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	2,2-diF
20 -832	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	2,2-diF
20 -833	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	2, 2-diF
20 -834	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	2, 2-diF

WO 03/015781 PCT/JP02/08276

294

20-835	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	2, 2-diF
20-836	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	2, 2-diF
20-837	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	2,2-diF
20-838	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	2,2-diF
20-839	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	2, 2-diF
20-840	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	2, 2-diF
20-841	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	2, 2-diF
20-842	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	2, 2-diF
20-843	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	2, 2-diF
20-844	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	2, 2-diF
20-845	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	2, 2-diF
20-846	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	2, 2-diF
20-847	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	2, 2-diF
20-848	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	2, 2-diF
20-849	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	2, 2-diF
20-850	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	2, 2-diF
20-851	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	2, 2-diF
20-852	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 1	8-Me
20-853	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 2	8-Me
20-854	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 3	8-Me
20-855	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 4	8-Me
20-856	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 5	8-Me
20-857	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 6	8-Me
20-858	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 7	8-Me
20-859	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 8	8-Me
20-860	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 9	8-Me
20-861	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 10	8-Me
20-862	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環11	8-Me
20-863	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 12	8-Me
20-864	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環13	8-Me
20-865	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 14	8-Me
20-866	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 15	8-Me
20-867	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 16	8-Me
20-868	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 17	8-Me
20-869	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 18	8-Me
20-870	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 19	8-Me

20-871	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 20	8-Me
20-872	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 21	8-Me
20-873	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 22	8-Me
20-874	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 23	8-Me
20-875	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 24	8-Me
20-876	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 25	8-Me
20-877	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 26	8-Me
20-878	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 27	8-Me
20-879	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 28	8-Me
20-880	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 29	8-Me
20-881	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 30	8-Me
20-882	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 31	8-Me
20-883	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 32	8-Me
20-884	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 33	8-Me
20-885	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 34	8-Me
20-886	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 35	8-Me
20-887	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 36	8-Me
20-888	4-F-Ph	2-MeNH-4-Pym	環 37	8-Me
20-889	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 1	H
20-890	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	H
20-891	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 3	H
20-892	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 4	H
20-893	4-F-Ph	$2-(\alpha-\text{Me-BnNH})-4-\text{Pym}$	環 5	H
20-894	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 6	H
20-895	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 7	H
20-896	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 8	H
20-897	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 9	H
20-898	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	H
20-899	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環11	H ~
20-900	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 12	H
20-901	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 13	H
20-902.	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 14	H
20-903	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 15	H
20-904	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環16	H
20-905	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 17	H
20-906	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 18	H

20-907	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 19	H
20-908	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	H
20-909	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 21	H
20-910	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 22	H
20-911	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 23	H
20-912	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 24	H
20-913	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 25	H
20-914	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 26	H
20-915	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 27	H
20-916	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	H
20-917	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 29	H
20-918	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 30	H
20-919	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 31	H
20-920	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 32	H
20-921	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 33	H
20-922	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 34	H
20-923	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 35	H
20-924	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 36	H
20-925	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 37	H
20-926	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 1	2-Me
20-927	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	2-Me
20-928	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 3	2-Me
20-929	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 4	2-Me
20-930	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 5	2-Me
20-931	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 6	2-Me
20-932	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 7	2-Me
20-933	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 8	2-Me
20-934	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 9	2-Me
20-935	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	2-Me
20-936	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環11	2-Me
20-937	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 12	2-Me
20-938	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 13	2-Me
20-939	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 14	2-Me
20-940	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 15	2-Me
20-941	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環16	2-Me
20-942	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 17	2-Me

20-943	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環18	2-Me
20-944	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 19	2-Me
20-945	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	2-Me
20-946	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 21	2-Me
20-947	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 22	2-Me
20-948	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	2-Me
20-949	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 24	2-Me
20-950	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 25	. 2-Me
20-951	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 26	2-Me
20-952	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 27	2-Me
20-953	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	2-Me
20-954	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 29	2-Me
20-955	4-F-Ph	$2-(\alpha-\text{Me-BnNH})-4-\text{Pym}$	環 30	2-Me
20-956	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 31	2-Me
20-957	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 32	2-Me
20-958	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 33	2-Me
20-959	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	2-Me
20-960	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 35	2-Me
20-961	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 36	2-Me
20-962	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 37	2-Me
20-963	4-F-Ph.	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 1	2-0H
20-964	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	2-0H
20-965	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 3	2-0H
20-966	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 4	2-0H
20-967	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 5	2-0H
20-968	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 6	2-0H
20-969	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 7	2-0H
20-970	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 8	2-0H
20-971	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 9	2-0H
20-972	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	2-0H
20-973	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 11	2-0H
20-974	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 12	2-0H
20-975	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 13	2-0H
20-976	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 14	2-0H
20-977	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 15	2-0H
20-978	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 16	2-0H

20-979	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 17	2-0H
20-980	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 18	2-0H
20-981	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 19	2-0H
20-982	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	2-0H
20-983	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 21	2-0H
20-984	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 22	2-0H
20-985	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 23	2-0H
20-986	4-F-Ph	. 2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 24	2-0H
20-987	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 25	2-0H
20-988	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 26	2-0H
20-989	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 27	2-0H
20-990	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 28	2-0H
20-991	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 29	2-0H
20-992	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 30	2-0H
20-993	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 31	2-0H
20-994	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 32	2-0H
20-995	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 33	2-0H
20-996	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	2-0H
20-997	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 35	2-0H
20-998	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 36	2-0H
20-999	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 37	2-0H
20-1000	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 1	2-Me0
20-1001	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	2-MeO
20-1002	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 3	2-Me0
20-1003	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 4	2-MeO
20-1004	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 5	2-MeO
20-1005	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 6	2-MeO
20-1006	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 7	2-MeO
20-1007	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 8	2-MeO
20-1008	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 9	2-MeO
20-1009	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	2-Me0
20-1010	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 11	2-Me0
20-1011	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 12	2-Me0
20-1012	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 13	2-Me0
20-1013	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 14	2-Me0
20-1014	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 15	2-Me0

WO 03/015781 PCT/JP02/08276

20-1015	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 16	2-Me0
20-1016	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環17	2-MeO
.20-1017	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 18	2-MeO
20-1018	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 19	2-MeO
20-1019	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 20	2-MeO
20-1020	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 21	2-MeO
20-1021	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 22	2-Me0
20-1022	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	2-MeO
20-1023	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 24	2-MeO
20-1024	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 25	2-MeO
20-1025	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 26	2-MeO
20-1026	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 27	2-MeO
20-1027	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	2-MeO
20-1028	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 29	2-Me0
20-1029	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 30	2-Me0
20-1030	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 31	2-MeO
20-1031	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 32	2-Me0
20-1032	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 33	2-Me0
20-1033	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 34	2-MeO
20-1034	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 35	2-Me0
20-1035	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 36	2-Me0
20-1036	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 37	2-Me0
20-1037	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 1	2-F
20-1038	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 2	2-F
20-1039	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 3	2-F
20-1040	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 4	2-F
20-1041	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 5	2-F
20-1042	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 6	2-F
20-1043	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	,環 7	2-F
20-1044	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 8	2-F
20-1045	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 9	2-F
20-1046	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-$ 4-Pym	環10	2-F
20-1047	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環11	2-F
20-1048	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 12	2-F
20-1049	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環13	2-F
20-1050	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 14	2-F

20-1051	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 15	2-F
20-1052	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 16	2-F
20-1053	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 17	2-F
20-1054	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 18	2-F
20-1055	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 19	2-F
20-1056	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 20	2-F
20-1057	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 21	2-F
20-1058	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 22	2-F
20-1059	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 23	2-F
20-1060	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 24	2-F
20-1061	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 25	2-F
20-1062	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 26	2-F
20-1063	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 27	2-F
20-1064	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 28	2-F
20-1065	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 29	2-F
20-1066	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 30	2-F
20-1067	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 31	2-F
20-1068	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 32	2-F
20-1069	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 33	2-F
20-1070	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 34	2-F
20-1071	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 35	2-F
20-1072	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 36	2-F
20-1073	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 37	2-F
20-1074	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 1	2-C1
20-1075	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 2	2-C1
20-1076	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 3	2-C1
20-1077	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 4	2-C1
20-1078	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 5	2-C1
20-1079	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 6	2-C1
20-1080	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 7	2-C1
20-1081	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 8	2-C1
20-1082	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 9	2-C1
20-1083	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 10	2-C1
20-1084	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 11	2-C1
20-1085	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 12	2-C1
20-1086	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 13	2-C1

20-1087	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 14	2-C1
20-1088	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 15	2-C1
20-1089	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 16	2-C1
20-1090	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 17	2-C1
20-1091	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 18	2-C1
20-1092	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 19	2-C1
20-1093	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 20	2-C1
20-1094	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 21	2-C1
20-1095	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 22	2-C1
20-1096	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	2-C1
20-1097	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 24	2-C1
20-1098	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 25	2-C1
20-1099	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 26	2-C1
20-1100	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 27	2-C1
20-1101	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 28	2-C1
20-1102	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 29	2-C1
20-1103	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 30	2-C1
20-1104	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 31	2-C1
20-1105	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 32	2-C1
20-1106	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 33	2-C1
20-1107	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	2-C1
20-1108	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 35	2-C1
20-1109	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 36	2-C1
20-1110	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 37	2-C1
20-1111	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 1	2, 2-diF
20-1112	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 2	2, 2-diF
20-1113	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 3	2, 2-diF
20-1114	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 4	2,2-diF
20-1115	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 5	2,2-diF
20-1116	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 6	2,2-diF
20-1117	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 7	2, 2-diF
20-1118	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 8	2, 2-diF
20-1119	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 9	2, 2-diF
20-1120	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 10	2, 2-diF
20-1121	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環11	2, 2-diF
20-1122	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 12	2, 2-diF

20-1123	4-F-Ph	$2$ -( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 13	2, 2-diF
20-1124	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 14	2, 2-diF
20-1125	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 15	2,2-diF
20-1126	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 16	2, 2-diF
20-1127	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 17	2, 2-diF
20-1128	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環18	2, 2-diF
20-1129	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 19	2, 2-diF
20-1130	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 20	2,2-diF
20-1131	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 21	2,2-diF
20-1132	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 22	2,2-diF
20-1133	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	2, 2-diF
20-1134	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 24	2,2-diF
20-1135	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 25	2, 2-diF
20-1136	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 26	2, 2-diF
20-1137	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 27	2,2-diF
20-1138	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 28	2, 2-diF
20-1139	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 29	2,2-diF
20-1140	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 30	2, 2-diF
20-1141	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 31	2,2-diF
20-1142	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 32	2, 2-diF
20-1143	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 33	2,2-diF
20-1144	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	2,2-diF
20-1145	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 35	2,2-diF
20-1146	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 36	2, 2-diF
20-1147	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 37	2, 2-d i F
20-1148	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 1	8-Me
20-1149	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 2	8-Me
20-1150	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 3	8-Me
20-1151	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 4	8-Me
20-1152	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 5	8-Me
20-1153	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 6	8-Me
20-1154	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 7	8-Me
20-1155	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 8	8-Me
20-1156	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 9	8-Me
20-1157	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環10	8-Me
20-1158	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環11	8-Me

20-1159	4-F-Ph	2-(α-Me-BnNH)-4-Pym	環12	8-Me	
20-1160	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 13	8-Me	
20-1161	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 14	8-Me	
20-1162	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 15	8-Me	
20-1163	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環16	8-Me	
20-1164	4-F-Ph	2-(α-Me-BnNH)-4-Pym	環17	8-Me	
20-1165	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環18	8-Me	
20-1166	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 19	8-Me	
20-1167	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 20	8-Me	
20-1168	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 21	8-Me	
20-1169	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 22	8-Me	
20-1170	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 23	8-Me	
20-1171	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 24	8-Me	
20-1172	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 25	8-Me	
20-1173	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 26	8-Me	
20-1174	4-F-Ph	2-( $\alpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 27	8-Me	
20-1175	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) $-4-$ Pym	環 28	8-Me	
20-1176	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 29	8-Me	
20-1177	4-F-Ph	2- ( $lpha$ -Me-BnNH) -4-Pym	環 30	8-Me	
20-1178	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 31	8-Me	
20-1179	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 32	8-Me	
20-1180	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 33	8-Me	
20-1181	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 34	8-Me	
20-1182	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 35	8-Me	
20-1183	4-F-Ph	2-( $lpha$ -Me-BnNH)-4-Pym	環 36	8-Me	
20-1184	4-F-Ph	$2-(\alpha-Me-BnNH)-4-Pym$	環 37	8-Me	

上記表中、「Ac」はアセチルを示し、「Allyl」はアリルを示し、「Azt」はアゼチジニルを示し、「Bn」はベンジルを示し、「Bu」はブチルを示し、「tBu」は t ーブチルを示し、「Et」はエチルを示し、「Hp」はヘプチルを示し、「Hx」はヘキシルを示し、「CHx」はシクロヘキシルを示し、「Ind」はインドリジニルを示し、「Me」はメチルを示し、「Nn」はノニルを示し、「Oc」はオクチルを示し、「Ph」はフェニルを示し、「Phet」はフェネチルを示し、「Propargyl」はプロパルギルを示し、「Pip」はピペリジルを示し、「deH-Pip」はデヒドロピペリジル(即ち、テトラヒドロピリジル)を示し、「Pn」はペンチルを示し、「cPn」はシクロペンチルを示し、「Pr」はプロピルを示し、「iPr」はイソプロピルを示し、「cPr」はシクロプロピルを示し、「Pym」はピリミジニルを示し、「Pyr」はピリジルを示し、「Qui」はキノリジニルを示し、「>CH2」はメチリデニルを示し、「>CHMe」はエチリデニルを示し、「>CHBt」はプロピリデニルを示し、「>C(Me)」はイソプロピリデニルを示し、「>CHPr」はブチリデニルを示し、「>CHPr」はブチリデニルを示し、「>CHPr」はブチリデニルを示し、「>CHPr」はブチリデニルを示し、「>CHPr」はブチリデニルを示し、「>CHPr」はブチリデニルを示し、「>CHPr」はブチリデニルを示し、「>CHPr」はブチリデニルを示し、「>CHPr」はベンジリデニルを示す。

表18、表19及び表20のAの欄における「環1」乃至「環37」の表示は、 それぞれ、下記表21の環を示す。

表 2 1

			42.2		
環 1:	-\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	環 2:	-\(\frac{1}{5}\) CH3	環 3:	żr żi
環 4:	S CH <sub>3</sub>	環 5:		環 6:	ÇH₃
環 7:		環 8:	ZY YK	環 9:	N SN
環 10:	y S S	環 11:	ży Zi	環 12:	-}~
環 13:	7.4. N	環 14:	-\(\frac{1}{2}\text{N}\) CH3	環 15:	
環 16:	ŽŽ N CH₃	環 17:	- SOCH <sub>3</sub>	環 18:	NH NH

環 19:	**************************************	環 20:	-1- N=	~~\ 		環 21:	y <sub>y</sub> CH <sub>3</sub>
環 22:	. CH3	環 23:	- X	CH <sub>3</sub>		環 24:	i CI
環 25:	NH NH	環 26:		Ž,	SOCH <sub>3</sub>	環 27:	Y NH
環 28:	**************************************	環 29:	1, N	کٹر N = CH₃		環 30:	SOCHS
環 31:	74 24 2 2	環 32:	} \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\ \\	CH <sub>3</sub>		環 33:	2, N=N CI
· 環 34:	- 1- N=N	-SOCH <sub>3</sub>		環 35:	75-1	=N	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
環 36:	1/N=N	NH		環 37:	74 N		N-CH <sub>3</sub>

上記表 21 中の各々の環において、一番左に記載される結合手に  $R^1$  が結合する。尚、上記表 8、表 10、表 12、表 14 及び表 16 において、  $R^4$  が水素原子である化合物に言及しているが、これらは下記に示すような互変異性を有している。

上記表 8 、表 1 0 、表 1 2 、表 1 4 及び表 1 6 における例示はいずれの化合物をも意図するものである。

- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-(ピペリジン-4-イル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・2 (4 フルオロフェニル) 4 (1 メチル- 1 , 2 , 3 , 6 テトラヒドロピリジン- 4 イル) 3 (ピリジン- 4 イル) 1 + ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-(1-メチルピペリジン-4-イル)-3-(ピリジン<math>-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・3-(4-7ルオロフェニル)-2-(ピリジン-4-7ル)-1-(2, 2, 2)
- 6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル)-1H-ピロール、
- ・2 (4 フルオロフェニル) 4 (4 ヒドロキシピペリジン- 4 イル) 3 (ピリジン- 4 イル) 1 + ピロール、
- $\cdot 2 (4 7 \mu + 
- 3, 6-テトラヒドロー 2, 2, 6, 6-テトラメチルピリジンー 4-イル) 1 H- ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-(2-)チル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-4-イル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール、
- ・2 (4 フルオロフェニル) 4 (6 メチル- 1, 2, 3, 6 テトラヒドロピリジン- 4 イル) 3 (ピリジン- 4 イル) 1 H ピロール、
- ・4-(1-エチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-4-イル)-2
- -(4-7)ルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-7)ル)-1 H-ピロール、
- ・4-(1-エチルピペリジン-4-イル)-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-(1-4)プロピル-1, 2, 3, 6-5トラヒドロピリジン-4-4ル)-3-(ピリジン-4-4ル)-1H-ピロール、
- ・2-(4-フルオロフェニル)-4-(1-プロピル-1, 2, 3, 6-テト

- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4- (1, 2, 3, 5, 8, 8a-へキサヒドロインドリジン<math>-7-イル)-3- (ピリジン<math>-4-イル)-1 H-ピロール、・2 (4-7)ルオロフェニル)-4- (1, 2, 3, 5, 6, 8a-へキサヒドロインドリジン<math>-7-イル)-3- (ピリジン<math>-4-イル)-1 H-ピロール、・4 (1, 6-ジメチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-4-イル)-2- (4-7)ルオロフェニル)-3- (ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・4-(1,2-ジメチル-1,2,3,6-テトラヒドロピリジン-4-イル) -2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-(1, 2, 2, 6, 6-ペンタメチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン<math>-4-7ル)-3-(ピリジン-4-7)ル)-1 H-ピロール、
- ・4-(1-x+y-6-y+y-1, 2, 3, 6-y+y-1) 4-(1-x+y-6-y+y-1, 2, 3, 6-y+y-1) 3-(2y+y-4-4y) 1+y+y-1 1+y+y-1
- ・4- (1-x+y-2-y+y-1, 2, 3, 6-x+y-1) (1-x+y-2-y+y-1, 2, 3, 6-x+y-1) (1-x+y-2-y+y-1, 2, 3, 6-x+y-1) (1-x+y-2-y+y-1, 2, 3, 6-x+y-1) (1-x+y-1) - ・4-(6-7)ルー1-メチルー1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジンー4-イル)-2-(4-7)ルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 H -ピロール、

WO 03/015781

- ・4-(2-7)ルー1-メチルー1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジンー4ーイル)-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジンー4-イル)-1 Hーピロール、
- ・4-(6-ベンジル-1-メチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-4-イル)-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・4-(2-ペンジル-1-メチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-4-イル)-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-(6-3)チルー1-7ロピルー1, 2, 3, 6-7トラヒドロピリジン-4-7ル)-3-(ピリジン<math>-4-7ル)-1H-ピロール、
- ・2-(4-フルオロフェニル) -4-(1,3,4,6,7,9a-ヘキサヒドロ-2H-キノリジン-8-イル) -3-(ピリジン-4-イル) -1H-ピロール、
- ・2-(4-フルオロフェニル) -4-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -3-(2-メチルアミノピリミジン-4-イル) -1H-ピロール、
- ・2-(4-フルオロフェニル) -4-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -3-(2-メチルアミノピリミジン-4-イル) -1H-ピロール、
- ・2-(3,4-ジフルオロフェニル)-4-(1,2,3,5,8,8a- $^{\circ}$ キサヒドロインドリジン-7-イル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピ

ロール、

- ・4-(1, 2, 3, 5, 8, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-3-(ピリジン-4-イル)-2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1H-ピロール、
- ・4-(1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-3-(ピリジン-4-イル)-2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1H-ピロール、
- ・2-(3-フルオロフェニル) -4-(1, 2, 3, 5, 8, 8 a  $^{+}$ サヒドロインドリジン- $^{7}$ -イル) -3-(ピリジン- $^{4}$ -イル) -1 H-ピロール、
- ・2 (3-7)ルオロフェニル)-4- (1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・2 (3-クロロフェニル) 4 (1, 2, 3, 5, 8, 8a -へキサヒドロインドリジン- (7-7 -
- ・2 (3-クロロフェニル) 4 (1, 2, 3, 5, 6, 8a -ヘキサヒドロインドリジン- (7-7 -
- ・4-(1, 2, 3, 5, 8, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-2-フェニル-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール、
- ・4-(1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) 2-フェニル-3-(ピリジン-4-イル) 1 H-ピロール、
- ・2 (3 フルオロフェニル) 4 [2 メチル- 1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル] 3 (ピリジン- 4 イル) 1 H ピロール、
- ・2 (3-7)ルオロフェニル) 4-[2-7]ェニル 1 , 2 , 3 , 5 , 6 , 8 a 4

- ・2 (3-7)ルオロフェニル)-4-[2-メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン<math>-7-7ル]-3-(ピリジン<math>-4-7ル) -1 H-ピロール、
- ・ $4-[2-7ルオロ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda$ キサヒドロインドリジン-7-7ル]-2-(3-7)ルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-7) -1 H-ピロール、
- ・2 (4-フルオロフェニル) -4 [2-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] <math>-3 (ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[2-ヒドロキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・4-[2, 2-xチレンジオキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a- ヘキサヒドロインドリジン-7- イル]-2-(4- フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4- イル)-1 H- ピロール、
- ・2-(4-フルオロフェニル) -4-[2-オキソ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7 イル] -3-(ピリジン-4 イル) -1 H ピロール、
- ・4-[2-7ルオロ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-4+サヒドロインドリジン-7-4ル]-2-(4-7ルオロフェニル)-3-(ピリジン<math>-4-4ル)-1Hーピロール、

- ・ $4-[2-クロロ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda$ キサヒドロインドリジンー 7ーイル] -2-(4-7)オロフェニル) -3-(ピリジン-4-7) -1 Hーピロール、
- ・4-[2, 2-ジフルオロ-1, 2, 3, 5, 6, 8a- へキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール、
- ・2 (3-クロロフェニル)-4- [2-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a -ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1 H
- ・2-(3-クロロフェニル) -4-[2-フェニル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール、
- ・2-(3-クロロフェニル) -4-[2-ヒドロキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -1H-ピロール、
- ・2 (3 クロロフェニル) -4 [2 メトキシ- 1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル] 3 (ピリジン- 4 イル) 1 + ピロール、
- ・2 (3 クロロフェニル) -4 [2 フルオロ- 1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル] 3 (ピリジン- 4 イル) 1 ピロール、
- ・ $4-[2-クロロ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda$ キサヒドロインドリジン-7-イル] -2-(3-クロロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H -ピロール、
- ・ $4-[2-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda$ キサヒドロインドリジンー 7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1 Hーピロール、

エニル) - 1 H - ピロール、

- ・4-[2-ヒドロキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -2-(3-トリフルオロメチルフェニル) <math>-1H-ピロール、
- ・4-[2-メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -2-(3-トリフルオロメチルフェニル) -1 H-ピロール、
- ・ $4-[2-7ルオロ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda$ キサヒドロインドリジン-7-4ル] -3-(ピリジン-4-4ル) -2-(3-トリフルオロメチルフェニル) -1 H-ピロール、
- ・4-[2-クロロ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -2-(3-トリフルオロメチルフェニル) <math>-1 H-ピロール、
- ・ $4-[2,8-ジメチル-1,2,3,5,6,8a-\Lambda+サヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、$
- ・2 (4 フルオロフェニル) 4 [2 ヒドロキシ- 8 メチル- 1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル] 3 (ピリジン-
- 4-イル)-1H-ピロール、
- 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -3- (ピリジン-4-イル) -1H-ピロール、
- ・4-[2-7ルオロ-8-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-7ルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・4-[2-2-2-8-3] 2, 3, 5, 6, 8 a-3 + b+1 1, 2, 3, 5, 6, 8 a-3 + b+1 1 a-1 1
- ・2-(4-フルオロフェニル) -4-[2-メチル-3, 5, 6, 8 a ーテト

- ラヒドロインドリジン-7-イル] -3- (ピリジン-4-イル) -1H-ピロール、

- 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル] 3 (ピリジン- 4 イル) 1 H ピロール、
- ・4-[2-クロロ-1, 2, 3, 5, 8, 8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-<math>4-イル) -1 H-ピロール、
- ・4-[2, 2-ジフルオロ-1, 2, 3, 5, 8, 8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール、
- ・4-(6-スピロシクロプロパン-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[2-メチリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・ $4-[2, 2-ジメチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda+サヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール$

- ・ $4-[2-エチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda$ キサヒドロインドリジンー 7-イル] -2-(3-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール
- ・4-[2-エチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -2-(3-トリフルオロメチルフェニル) -1 H-ピロール
- ・2 (4- $\rho$ - $\rho$
- ・ $4-[2-プチルチオー1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda+サヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール$
- ・4-[2-エチルチオ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール
- ・4-[2-エチリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[2-7]ロピル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-4+サヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール
- ・2 (3-クロロフェニル) -4- [2-プロピル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル) -1

Hーピロール

- ・ $4-[2-プロピル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda$ キサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -2-(3-トリフルオロメチルフェニル) -1 H-ピロール
- ・4-[2-Xトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1H-ピロ-ル
- ・4-(2-スピロシクロペンタン-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール
- ・4-[2-ベンジリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[2-7]ロピリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-4+サヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール
- ・4-[5,5-ジメチル-1,2,3,5,6,8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール
- ・4-[2-エチル-3, 5, 6, 8a-テトラヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[2-7]ロピル-3, 5, 6, 8a-7トラヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン<math>-4-イル)-1 H-ピロール
- ・2-(4-フルオロフェニル) -4-[2-フェニル-3, 5, 6, 8 a-テ

トラヒドロインドリジン-7-イル] -3- (ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール

- ・2 (4-クロロフェニル)-4- [2-メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール
- ・2 (4-クロロフェニル)-4- [2-フェニル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3- (ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・5 (3-7)ルオロフェニル) -3-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・5 (4-7)ルオロフェニル)-3-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-5)キサヒドロインドリジン-7-7ル)-4-(ピリジン-4-7) ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-3) チルー1, 2, 3, 5, 6, 8 a-4 サヒドロインドリジンー7-4 ル)-4-(ピリジン-4-4) ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-7)ェニル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-4 サヒドロインドリジン-7 イル)-4 (ピリジン-4 イル)ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-1) に -4-1 に -1 に -4 に -
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-1)+シー1, 2, 3, 5, 6, 8 a -1+サヒドロインドリジン-7-イル)-4-(2)ジン-4-イル)ピラゾール、

- ・3-(2-7)ルオロ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -5-(4-7)ルオロフェニル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・3-(2, 2-ジフルオロ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-5-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール、
- ・5-(3-クロロフェニル) -3-(1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・3-(1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) 4-(ピリジン-4-イル) -5-(3-トリフルオロメチルフェニル) ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-4) ピラドロインドリジン-7-7ル)-1-メチル-4-(ピリジン-4-7) ピラゾール、
- ・3-(4-7)ルオロフェニル)-5-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-4) ドロインドリジン-7-7ル)-1-メチル-4-(ピリジン-4-7) ピラゾール、
- ・3-(4-7)ルオロフェニル)-1-メチル-5-(2-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール、
- ・3-(4-7)ルオロフェニル)-1-メチル-5-(2-7)ェニル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール、

- 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) 1 メチル-4 (ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・3 (4 7  $\nu$  + 1  $\nu$  + 1 + 2 + 1 + 2 + 1 +
- ・5-(2-7)ルオロー1, 2, 3, 5, 6, 8a-4+サヒドロインドリジンー7-4ル)-3-(4-7)ルオロフェニル)-1-メチルー4-(ピリジン-4-4) ピラゾール、
- ・5 (2, 2-ジフルオロ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-3-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-4-(29)ジン-4-7ル)-3-(3,5,6,8a-テトラヒドロインドリジン-7-7ル)ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-4)サヒドロインドリジン-7-7ル)-4-(ピリジン-4-7)ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(7-2) にはいまシー1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a-3 クタヒドロインドリジン-7-7 ル)-4-(2) ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(1,2,3,5,6,7,8,8a-4)オクタヒドロインドリジン-7-7ル)-4-(ピリジン-4-7) ピラゾール、
- ・4-(4-7)ルオロフェニル)-1-(1,2,3,5,6,7,8,8a-4)オクタヒドロインドリジン-7-7イル)-5-(ピリジン<math>-4-7ル) イミダゾール、

- ・3-(2-エチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-5-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラ ゾール、
- 8 a - ヘキサヒドロインドリジンー 7 - イル) - 4 - (ピリジンー 4 - イル) ピ ラゾール、
- 8 a - ヘキサヒドロインドリジン - 7 - イル) - 4 - (ピリジン - 4 - イル) ピ ラゾール、
- ・3-(2-エチリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジ ンー7ーイル) -5-(4-フルオロフェニル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- 6,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- 5, 6, 8 a - ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) - 4- (ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- 3. 5. 6. 8 a - ヘキサヒドロインドリジン- 7 - イル) - 4 - (ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- 8 a - ヘキサヒドロインドリジンー 7 - イル) - 1 - メチル-4 - (ピリジンー 4-イル) ピラゾール、
- 8 a - ヘキサヒドロインドリジンー 7 - イル) - 1 - メチルー4 - (ピリジンー 4-イル) ピラゾール、
- ・3 (2-フルオロー1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン **-7-イル)-5-(4-フルオロフェニル)-1-メチル-4-(ピリジン-**

4-イル) ピラゾール、

- ・5-(4-フルオロフェニル) -3-(2-メチル-3, 5, 6, 8a-テトラヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、・3-(2-エチル-3, 5, 6, 8a-テトラヒドロインドリジン-7-イル)
- -5-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール、
- ・5-(4-フルオロフェニル) -3-(2-プロピル-3, 5, 6, 8 a-テトラヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-7)ェニル-3, 5, 6, 8a-テトラヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール及び
- ・2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-4-[(8 a S)-3, 5, 6, 8 a テトラヒドロインドリジン-7-イル]-1 H-ピロールである。

さらにより好適な化合物は、

- ・2 (4-7)ルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-7) -4-(1, 2, 3. 6-テトラヒドロピリジン-4-7) <math>-1 H-ピロール、
- ・2-(4-フルオロフェニル) -4-(1-メチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-4-イル) -3-(ピリジン-4-イル) -1H-ピロール、
- ・2-(4-フルオロフェニル) -4-(6-メチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-4-イル) -3-(ピリジン-4-イル) -1H-ピロール、
- ・4-(1-エチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-4-イル)-2
- -(4-7)ルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-7)ル-1 H ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-(1-4)プロピル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-4-4ル)-3-(ピリジン<math>-4-4ル)-1H-ピロール、

- ラヒドロピリジンー4- (1) 3 (2) 4 (1) 1 + (1) -
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4- (1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-3- (ピリジン<math>-4-イル)-1 H-ピロール、・4- (1, 6-ジメチル-1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-4-イル)-2- (4-7)ルオロフェニル)-3- (ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-(6-)チルー1-プロピルー1, 2, 3, 6-テトラヒドロピリジン-4-イル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル) -4-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-キサヒドロインドリジン-7-イル) -3-(2-メチルアミノピリミジン-4-イル) -1 H-ピロール、
- ・2-(3,4-ジフルオロフェニル)-4-(1,2,3,5,6,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール、
- ・4-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -3-(ピリジン-4-イル) -2-(3-トリフルオロメチルフェニル) -1 H -ピロール、
- ・2-(3-フルオロフェニル) -4-(1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール、・2-(3-クロロフェニル) -4-(1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサレビ
- ・4-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-

- 2-フェニル-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール、

- 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-
- 1 H-ピロール、
- 8 a ヘキサヒドロインドリジンー 7 イル] 3 (ピリジンー 4 イル) -
- 1 H-ピロール、
- ・2-(3-フルオロフェニル)-4-[2-メトキシ-1, 2, 3, 5, 6,
- 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-
- 1 Hーピロール、
- ・4-[2-フルオロ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン
- -7-イル]-2-(3-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-
- 1 H ー ピロール、
- ・2-(4-フルオロフェニル)-4-[2-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8
- a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1
- H-ピロール、
- 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-
- 1 Hーピロール、
- 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル ] 3 (ピリジン-4-イル) -
- 1 Hーピロール、
- 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル] 3 (ピリジン- 4 イル) -
- 1 H-ピロール、
- ・4-[2, 2-エチレンジオキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロ

- インドリジンー7ーイル] -2ー(4ーフルオロフェニル) -3ー(ピリジンー4ーイル) -1 Hーピロール、
- ・ $4-[2-フルオロ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda+サヒドロインドリジン$ -7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール、
  - ・4-[2-Dロロ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-4ル]-2-(4-7ルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-4ル)-1Hーピロール、
  - ・2 (3- $\rho$ - $\rho$
  - ・2 (3 クロロフェニル) 4 [2 フェニル- 1, 2, 3, 5, 6, 8 4 4 + 4 + 7 + 7 + 7 + 7 + 7 + 8 + 9
  - ・2 (3- $\rho$ - $\rho$

  - ・ $4-[2-クロロ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda$ キサヒドロインドリジンー 7ーイル] -2-(3-クロロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1Hーピロール、
  - ・4-[2-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジンー 7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1 H-ピロール、

- ・4- [2-7x-2-1, 2, 3, 5, 6, 8a-4+7+1] [2-7x-2-1, 2, 3, 5, 6, 8a-4+7+1] [2-7x-2-1] -
- ・4-[2-ヒドロキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン<math>-4-イル)-2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1 H-ピロール、
- ・4-[2-メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1H-ピロール、
- ・4- [2-7ルオロ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-4+サヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1H-ピロール、
- ・4-[2-クロロ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-へキサヒドロインドリジンー7-イル-3-(ピリジン-4-イル)-2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[2-メチル-3, 5, 6, 8a-テトラヒドロインドリジン<math>-7-7ル]-3-(ピリジン<math>-4-7ル) -1 H-ピロール、
- ・4-(6-スピロシクロプロパン-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール
- ・4-[2, 2-ジメチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール

- 1 H ピロール
- ・ $4-[2-エチルー1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambdaキサヒドロインドリジンー7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジンー<math>4-イル)-1$  Hーピロール
- ・ $4-[2-エチルー1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambdaキサヒドロインドリジンー7-イル]-2-(3-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-<math>4-イル$ )-1 Hーピロール
- ・2-(3-クロロフェニル)-4-[2-エチル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a -ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1+0-ピロール
- ・2-(4-クロロフェニル)-4-[2-エチル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a -ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1H -ピロール
- ・ $4-[2-プチルチオー1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambdaキサヒドロインドリジ$ ンー7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 Hーピロール
- ・4-[2-xチルチオー1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジンー7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジンー4-イル)-1 H-ピロール
- ・4-[2-xチリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール

- 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル] 3 (ピリジン- 4 イル) 1 H ピロール
- ・2 (3- $\rho$ - $\rho$
- ・ $4-[2-プロピル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda+サヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -2-(3-トリフルオロメチルフェニル) <math>-1$  H-ピロール
- ・2 (4-クロロフェニル)-4- [2-プロピル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3- (ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール
- ・4-[2-エトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1H-ピロール
- ・4-(2- スピロシクロペンタン-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール
- ・4-[2-ベンジリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール
- ・4-[5,5-ジメチル-1,2,3,5,6,8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール

- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[2-7]ロピル-3, 5, 6, 8a-テトラヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン<math>-4-イル)-1 H-ピロール
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[2-7)ェニル-3, 5, 6, 8a-7トラヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン<math>-4-イル)-1 H-ピロール
- ・2 (4-クロロフェニル)-4- [2-メチル-1, 2 , 3 , 5 , 6 , 8 a -ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -3- (ピリジン<math>-4-イル) -1H -ピロール

- ・5 (3 フルオロフェニル) 3 (1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-4)サヒドロインドリジン-7-7ル)-4-(ピリジン-4-7) ピラゾール、

- ・5 (4 フルオロフェニル) 3 (2 ヒドロキシ- 1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピ

ラゾール、

- ・3-(2-フルオロ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -5-(4-フルオロフェニル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・3-(2,2-ジフルオロ-1,2,3,5,6,8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-5-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール、
- ・5-(4-フルオロフェニル)-3-(8-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8  $a-\Delta$ +サヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール、
- ・5-(3-クロロフェニル) -3-(1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・3-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル)-5-(3-トリフルオロメチルフェニル)ピラゾール、
- ・5-(3, 4-ジフルオロフェニル) -3-(1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・5 (4-7)ルオロフェニル)-3-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-4) ドロインドリジン-7-7 (ピリジン-4-7) ピラゾール、
- ・3-(4-フルオロフェニル)-5-(1, 2, 3, 5, 6, 8 a- $\wedge$ +サヒドロインドリジン-7-イル)-1-メチル-4-(ピリジン-4-イル)ピラソール、
- ・3-(4-フルオロフェニル) -1-メチル-5-(2-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a  $\wedge$  +  $\psi$  ヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、

- ・3-(4-フルオロフェニル) -1-メチル-5-(2-フェニル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・3-(4-フルオロフェニル) -5-(2-ヒドロキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -1-メチル-4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・3-(4-フルオロフェニル) -5-(2-メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -1-メチル-4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・5-(2-フルオロー1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン -7 イル) -3 (4-フルオロフェニル) -1 メチル -4 (ピリジン -4 イル)ピラゾール、
- ・5-(2,2-ジフルオロ-1,2,3,5,6,8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -3-(4-フルオロフェニル) -1-メチル-4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・3-(4-フルオロフェニル) -1-メチル-5-(8-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・5-(4-フルオロフェニル) -4-(ピリジン-4-イル) -3-(3, 5, 6, 8 a-テトラヒドロインドリジン-7-イル) ピラゾール、
- ・5-(4-フルオロフェニル) -3-(7-ヒドロキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・5 (4 フルオロフェニル) -3 (1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール、
- ・4-(4-7)ルオロフェニル) -1-(1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-

オクタヒドロインドリジンー 7 ーイル) ー 5 ー (ピリジンー 4 ーイル) イミダゾール、

- ・5 (4  $\rho$   
- ・3-(2-エチル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -5-(4-フルオロフェニル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-7)ロピル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-4+サヒドロインドリジン-7-7ル)-4-(ピリジン-4-7) ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-3) チリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-4 サヒドロインドリジン-7 -1 -1 (ピリジン-4 -1 ) ピラゾール、
- ・5 (4-7)ルオロフェニル)-3-(2-7)ロピリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8a-4+サヒドロインドリジン-7-4ル)-4-(ピリジン-4-4)ピラゾール、
- ・5 (4-7)ルオロフェニル)-1-メチル-3-(2-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール、
- ・5 (4-7)ルオロフェニル)-1-メチル-3- (2-7)ェニル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン- 7-イル)-4- (ピリジン-4-イル)ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-1) ドロキシー1, 2, 3, 5, 6, 8a-4 サヒドロインドリジン-7-1 ル)-1-1 チルー4-(1) ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-3)キシー1, 2, 3, 5, 6,

- 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) 1 メチル-4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- - 7 - イル) - 5 - (4 - フルオロフェニル) - 1 - メチル-4 - (ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- 5, 6, 8 a - ヘキサヒドロインドリジン- 7 - イル) - 4 - (ピリジン- 4 -イル)ピラゾール、
- ・5-(4-フルオロフェニル)-3-(2-メチル-3,5,6,8a-テト ラヒドロインドリジンー7ーイル)ー4ー(ピリジンー4ーイル)ピラゾール、
- ・3-(2-エチル-3,5,6,8a-テトラヒドロインドリジン-7-イル) -5-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール、
- トラヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール ・5-(4-フルオロフェニル)-3-(2-フェニル-3, 5, 6, 8 a - テ トラヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール 及び
- ·2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-4-[(8 a S) である。

## 特に好適な化合物は、

- a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- 8 a - ヘキサヒドロインドリジン- 7 - イル] - 3 - (ピリジン- 4 - イル) -1 H - ピロール、
- 8 a - ヘキサヒドロインドリジン- 7 - イル] - 3 - (ピリジン- 4 - イル) -

- 1 Hーピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[2-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8]  $a-\Lambda$ キサヒドロインドリジン-7-4ル]-3-(ピリジン<math>-4-4ル)-1 H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[2-3)+キシ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-4+サヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン<math>-4-イル)-1H-ピロール、
- ・2 (3 クロロフェニル) -4 [2 メチル- 1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル] 3 (ピリジン- 4 イル) 1 + ピロール、
- ・2 (3 クロロフェニル) 4 [2 メトキシ- 1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル] 3 (ピリジン- 4 イル) 1 + ピロール、
- ・ $4-[2-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda$ キサヒドロインドリジンー 7-イル] -3-(ピリジン-4-イル)-2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1H-ピロール、
- ・4-[2-7エニルー1, 2, 3, 5, 6, 8a-4+サヒドロインドリジンー7-4ル]-3-(ピリジン-<math>4-4ル)-2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1 Hーピロール、
- ・4-[2-メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a- $\wedge$ +サヒドロインドリジン-7-(3-) -3-(ピリジン-4-(3-) -2-(3-トリフルオロメチルフェニル) -1 H-(ピロール)
- ・2-(4-フルオロフェニル)-4-[2-メチル-3, 5, 6, 8a-テト

ラヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール、

- ・4- [2-エチル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 Hーピロール、
- ・4- [2-エチル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -2- (3-フルオロフェニル) -3- (ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール、
- ・2 (3- $\rho$ - $\rho$
- ・4-[2-エチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジンー 7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -2-(3-トリフルオロメチルフェニル) -1 H-ピロール、

- ・2 (3-クロロフェニル) -4-[2-プロピル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン<math>-4-イル) -1 H-ピロール、
- ・4-  $[2-プロピル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda+サヒドロインドリジン$ -7- $[2-プロピル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda+サヒドロインドリジン$ -7- $[2-プロピル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda+サヒドロインドリジン$ -7-[2-7]-1-[2-7

- ・4-[2-エチル-3, 5, 6, 8a-テトラヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[2-7]ロピル-3, 5, 6, 8a-7トラヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン<math>-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[2-7]エニル-3, 5, 6, 8a-7トラヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン<math>-4-イル)-1H-ピロール、
- ・3 (1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7 イル) 5 フェニル-4 (ピリジン-4 イル) ピラゾール、
- ・5 (3 フルオロフェニル) 3 (1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール、
- -5-(4-7)ルオロフェニル) -3-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-4) ドロインドリジン-7-7ル) -4-(ピリジン-4-7) ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-3)チルー1, 2, 3, 5, 6, 8 a-4+サヒドロインドリジン-7-4ル)-4-(ピリジン-4-4ル)ピラゾール、

- ・5 (3 クロロフェニル) 3 (1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール、

- ・5-(3,4-ジフルオロフェニル)-3-(1,2,3,5,6,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール、
- ・5 (4 クロロフェニル) -3 (1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール、
- ・3-(2-エチル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -5-(4-フルオロフェニル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・5-(4-フルオロフェニル) -3-(2-プロピル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・3-(2-エチリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -5-(4-フルオロフェニル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・5-(4-フルオロフェニル) -3-(2-プロピリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8 a  $\wedge$  + サヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・5 (4-7)ルオロフェニル)-3-(2-3)キシ-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-4+サヒドロインドリジン-7-イル)-1-メチル-4- (ピリジン-4-イル)ピラゾール、
- ・5-(4-フルオロフェニル) -3-(2-メチル-3, 5, 6, 8a-テトラヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- $\cdot$ 3 (2 -エチル-3, 5, 6, 8 a テトラヒドロインドリジン-7 イル)
- -5-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール、
- ・5-(4-フルオロフェニル) -3-(2-プロピル-3, 5, 6, 8 a-テ

トラヒドロインドリジン-7-4ル) -4-(ピリジン-4-4ル) ピラゾール、・5-(4-7)ルオロフェニル) -3-(2-7)エニル-3, 5, 6, 8 a-7トラヒドロインドリジン-7-4ル) -4-(ピリジン-4-4ル) ピラゾール・4-[(8aS)-1, 2, 3, 5, 6, 8a-4サヒドロインドリジン-7-4ル] -2-7エニル-3-(ピリジン-4-4ル) -1H-ピロール、

- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[(8aS)-1,2,3,5,6,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-7ル]-3-(ピリジン<math>-4-7ル)-1 H -ピロール、
- ・2 (3-クロロフェニル)-4- [(8aS)-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3- (ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・ $4-[(8aS)-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda$ キサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル)-2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1H-ピロール、
- ・2 (3, 4-ジフルオロフェニル)  $-4-[(8aS)-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda$ キサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール、
- ・4-[(8aS)-2-エチリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール及び
- ・2 (4-7)ルオロフェニル)-4-[(8aS)-2-(2-7)ロピリデン)-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン<math>-4-イル)-1 H-ピロールである。

上記において、最も好適な化合物は、

- ・2-(4-フルオロフェニル) -4-[(2R, 8aS) -2-フェニル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -1H-ピロール(例示化合物番号 2-298)、
- ・2-(4-フルオロフェニル)-4-[(8 a S)-2-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール(例示化合物番号 2-293)、
- ・2-(4-フルオロフェニル)-4-[(8 a S)-2-メチリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール(例示化合物番号 2-982)、
- ・2-(4-フルオロフェニル)-4-[(8aS)-2-メチル-3, 5, 6, 8a-テトラヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール(例示化合物番号 4-1)、
- ・4-[(2S, 8aS) -2-エチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a- $^+$ +サヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1H-ピロール(例示化合物番号 2-294)、
- ・2-(4-フルオロフェニル)-4-[(2S, 8aS)-2-プロピルー1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール(例示化合物番号 2-295)、
- ・5 (3 フルオロフェニル) 3 (1, 2, 3, 5, 6, 8 a  $\wedge$  キサヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール(例示化合物番号 8 154)、
- ・5-(4-フルオロフェニル)-3-(1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール(例示化合物番号 8-307)、
- ・5 (4 フルオロフェニル) 3 (2 メチル- 1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール(例示化合物番号 8-312)、
- $\cdot 5 (4 7 \nu + 

- $8a-\Lambda$ キサヒドロインドリジン-7-イル) -4- (ピリジン-4-イル) ピラゾール(例示化合物番号 8-317)、
- ・5-(3-クロロフェニル) -3-(1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール(例示化合物番号 8-460)、
- ・3-(1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) 4-(ピリジン-4-イル) 5-(3-トリフルオロメチルフェニル) ピラゾール (例示化合物番号 8-613)、
- ・5-(3,4-ジフルオロフェニル)-3-(1,2,3,5,6,8a-へ キサヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール(例 示化合物番号 8-766)、
- ・3-(2-エチル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -5-(4-フルオロフェニル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラ ゾール (例示化合物番号 8-313)、
- ・5 (4 7 1 + 1
- ・5-(4-フルオロフェニル) -3-(2-メチリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール (例示化合物番号 8-1252)、
- ・3-(2-エチリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -5-(4-フルオロフェニル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール(例示化合物番号 8-1253)、
- ・5 (4 フルオロフェニル) -3 (2 プロピリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7 イル) -4 (ピリジン-4 イル) ピラゾール(例示化合物番号 8-1254)、
- ・5 (4 フルオロフェニル) -3 (2 メチル- 3, 5, 6, 8 a テトラヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール(例示化合物番号 12 2)、

- ・3 (2 x + y
- ・5-(4-フルオロフェニル)-3-(2-プロピル-3,5,6,8 a-テトラヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール(例示化合物番号 12-4)、
- ・5-(4-フルオロフェニル)-3-(2-フェニル-3, 5, 6, 8 a テトラヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール(例示化合物番号 12-7)
- ・4-[(8 a S) -1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -2-フェニル-3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール(例示化合物番号 1-886)、
- ・2-(4-フルオロフェニル)-4-[(8 a S)-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1 H ピロール (例示化合物番号 1-302)、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル) 3 (2) (2) (4-7) -
- ・2 (3 フルオロフェニル) 4 [(8 a S) 1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7 イル] 3 (ピリジン-4 イル) 1 H ピロール (例示化合物番号 1-888)、
- ・2-(3-クロロフェニル)-4-[(8 a S)-1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール(例示化合物番号 1-890)、
- ・4-[(8 a S) -1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7 イル] -3-(ピリジン-4-イル) -2-(3-トリフルオロメチルフェニル) -1 H-ピロール(例示化合物番号 1-894)、
- ・2  $(3, 4-\Im 7)$ ルオロフェニル) 4  $[(8aS) 1, 2, 3, 5, 6, 8a \Lambda + \Im 7 

1H-ピロール(例示化合物番号 1-892)、

- ・4-[(8 a S) 2 エチル-3, 5, 6, 8 a テトラヒドロインドリジン 7 イル] 2 (4 フルオロフェニル) 3 (ピリジン-4 イル) 1 H ピロール (例示化合物番号 4-2)、
- ・2 (4 フルオロフェニル) 4 [(8 a S) 2 フェニル- 3, 5, 6, 8 a テトラヒドロインドリジン- 7 イル] 3 (ピリジン- 4 イル) 1 H ピロール (例示化合物番号 4-6)、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル) -4-[(8aS)-2-(2-7)ロピリデン) -1, 2, 3, 5, 6, 8a-4 + サヒドロインドリジン -7-4 ル] -3-(ピリジン -4-4 ル) -1 H -1 ピロール (例示化合物番号 2-984)

## 及び

・5-(4-フルオロフェニル) -4-(ピリジン-4-イル) -3-(3, 5, 6, 8 a-テトラヒドロインドリジン-7-イル) ピラゾール(例示化合物番号 1 2-63)

である。

## [発明の実施の形態]

一般式(I)を有する化合物は以下に示すA法乃至D法に従って、容易に製造することができる。

## **<A法>**

A法は、一般式(I)を有する化合物のうち、R<sup>3</sup>が環A上の炭素原子に結合している化合物の製造方法である。

上記式中、A、R<sup>1</sup>及びR<sup>2</sup>は前記と同意義を示し、

環式基Hyは、前記一般式(IIa)、(IIb)、(IIc) 又は(IId)において点線を含む結合が単結合である基を示し、

環式基Hy'は、前記一般式(IIa)、(IIb)、(IIc)又は(IId)において点線を含む結合が二重結合である基を示す。

第1工程は、環式化合物(1)を臭素化剤(例えば、N-プロモコハク酸イミドなど)を用いて臭素化してプロモ環式化合物(2)を製造する工程であり、第2工程は、プロモ環式化合物(2)をリチオ化した後へテロシクリルケトン(3)と反応させて本発明の化合物(Ia)を製造する工程である。第1工程及び第2工程は、Brian L. Bray et al., J. Org. Chem., 55, 6317-6318(1990年)に詳述されている方法に従って実施することができる。

尚、化合物(Ia)は、環式化合物(1)を L. Revesz et al., Bioorg. Med. Chem. Lti., 10, 1261-1264(2000)に記載されているのと同様の方法で直接リチオ化し、得られた化合物とヘテロシクリルケトン(3)とを反応させることによっても製造することができる。

第3工程は、本発明の化合物(Ia)を脱水反応に付して、本発明の化合物(Ib)を製造する工程である。この脱水反応は、通常、硫酸などの酸触媒、アルミナなどの固体触媒、又はチオニルクロリドなどのハロゲン化剤の存在下に行われる[これらの反応は、例えば、G.H.Coleman & H.F.Johnstone, Org.Synth., I.

183(1941年)、R.L. Sawyer & D. W. Andrus, Org. Synth., III, 276(1955年)、及び J. S. Lomas et al., Tetrahedron Lett., 599(1971年)に詳述されている。]。また、本工程の脱水反応は、トリエチルシラン、トリプロピルシラン、トリプチルシランなどのトリアルキルシラン、及びトリフルオロ酢酸を用いた反応 [例えば、Francis A. Carey & Henry S. Tremper, J. Am. Chem. Soc., 91, 2967-2972(1969年)] によっても達成することができる。

第4工程は、本発明の化合物(Ib)の二重結合を還元して本発明の化合物(Ic)を製造する工程であり、例えば、S.M.Kerwin et al., J. Org. Chem., 52, 1686(1987)、T.Hudlicky et al., J. Org. Chem., 52, 4641(1987)などに記載されている方法に準じて実施することができる。

尚、上記A法において、Aが「2個の置換基群  $\delta$  で置換されてもよいピロール」である化合物を合成する場合には、予めピロールの 1 位の窒素原子が保護された化合物を第 1 工程に付し、第 2 工程又は第 3 工程の後に脱保護し、所望によりその窒素原子に置換基群  $\delta$  を導入することにより、そのような化合物を合成することが望ましい。

ピロールの1位の窒素原子の保護は、例えば、化合物(1)に相当するピロール化合物をテトラヒドロフラン300mlに溶解し、冷却下(例えば、-78 で)、ブチルリチウム及びトリイソプロピルシリルトリフラートを加え、室温で攪拌することにより実施することができる。脱保護反応は、通常、溶媒中、塩基の存在下に行なわれ、例えば、保護された化合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えることにより実施することができる。ピロールの1位への置換基群 $\delta$ の導入は、例えば、下記〈B法〉と同様の反応を行なうことにより達成される。

更に、上記A法において、一般式(IId)のD'又はE'が>NHである化合物を製造する場合、その窒素原子が保護された化合物を化合物(3)として用い、必要な工程を行なった後に所望により脱保護を行うことが望ましい。この保護反応及び脱保護反応としては、通常有機合成において汎用される脱保護反応(例えば、T.W. Greene et al., Protective Groups in Organic Synthesis, John Willey & Sons, Inc. に記載の反応)を採用することができる。

〈B法〉

B法は、環式基Aがピロール、ピラゾール又はイミダゾールであり、その窒素原子上にR<sup>3</sup>が結合している化合物の製造方法である。

〈B法〉

上記式中、R1、R2及びR3は、前記と同意義を示し、

環式基A、は、Aの定義における、「2個の置換基群 $\delta$ で置換されてもよいピロール」、「1個の置換基群 $\delta$ で置換されてもよいピラゾール」又は「1個の置換基群 $\delta$ で置換されてもよいイミダゾール」を示し、

# しは、脱離基を示す。

Lの定義における「脱離基」とは、通常、求核残基として脱離する基を示し、例えば、弗素、塩素、臭素、沃素のようなハロゲン原子;メタンスルホニルオキシ、エタンスルホニルオキシのような低級アルカンスルホニルオキシ基;トリフルオロメタンスルホニルオキシ、ペンタフルオロエタンスルホニルオキシのようなハロゲノ低級アルカンスルホニルオキシ基;ベンゼンスルホニルオキシ、ロートルエンスルホニルオキシ、 ロートルエンスルホニルオキシ、 ロートロベンゼンスルホニルオキシのようなアリールスルホニルオキシ基を挙げることができる。好適には、ハロゲン原子であり、特に好適には、臭素原子である。)

第5工程は、化合物(4)とヘテロシクリル化合物(5)とを反応させることにより、本発明の化合物(Id)を製造する工程である。本反応は、通常、溶媒中、塩基の存在下又は非存在下に行われる。

使用される溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノールのようなアルコール類;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類;ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシドのような非プロトン性極性溶媒;アセトニトリルのようなニトリル類;酢酸メチル、酢酸エチルのような

エステル類; ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類; ペンタン、ヘキサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類を挙げることができ、好適にはアルコール類が、更に好適にはメタノール又はエタノールが用いられる。

使用される塩基としては、例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムー t ープトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド類;水素化ナトリウム、水素化リチウムのようなアルカリ金属水素化物;水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物;炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩;トリエチルアミン、トリプチルアミン、ピリジン、ピコリン、1、8ージアザビシクロ[5.4.0]ー7ーウンデセンのようなアミン類が挙げられ、好適にはアミン類が、更に好適にはトリエチルアミン、ピリジン又は1、8ージアザビシクロ[5.4.0]ー7ーウンデセンが用いられる。

反応温度は、通常、-20℃乃至150℃で行なわれるが、好適には0℃乃至100℃である。反応時間は、通常、10分間乃至48時間であり、好適には30分間乃至12時間である。

尚、環Aがピラゾール又はイミダゾールであり、その窒素原子を置換基( $R^1$ 、  $R^2$ 、 $R^4$ 又は $R^4$ 'の定義における水素原子以外の基)で置換する場合、上記 B 法と同様に反応を行なうことにより、所望の置換基を導入することができる。

〈C法〉

C法は、前記一般式 (Id) において、環式基A' がイミダゾールである化合物を製造するための別法である。

〈C法〉

$$R^{2}$$
—CHO  $(7)$   $R^{3}$ —NH<sub>2</sub>  $(6)$  第  $6$  工程  $R^{3}$ —N=CH— $R^{2}$   $(8)$   $(9)$   $R^{2}$ —CH<sub>3</sub>  $R^{2}$ —N  $(1e)$ 

上記式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>及びR<sup>3</sup>は、前記と同意義を示す。

第6工程は、アミノ化合物(6)とアルデヒド化合物(7)とを脱水縮合させて、イミン化合物(8)を製造する工程であり、

第7工程は、イミン化合物(8)とイソシアニド化合物(9)とを反応させて本発明の化合物(Ie)を製造する工程である。

第6工程及び第7工程は、例えば、WO 9723479、WO 9725046、WO 9725047、WO 9725048、WO 9502591、J.L.Adams et al., Bioorg. Med. Chem. Lett., 8, 3111-3116(1998)等に詳述されている方法に従って実施される。

本発明の化合物(I)のうち、 $R^2$ が、 $NR^aR^b$ で置換された、窒素原子を少なくとも一つ有するヘテロアリール基である化合物(If)は、以下の〈D法〉によって製造することもできる。

(D法)

上記式中、A、R<sup>1</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>a</sup>及びR<sup>b</sup>は、前記と同意義を示し、

### L'は、脱離基を示し、

L'の定義における脱離基とは、Lの定義における脱離基と同様の基;メタンスルホニル、エタンスルホニル、プロパンスルホニル、ブタンスルホニルのような低級アルキルスルホニル基;又はベンゼンスルホニル、pートルエンスルホニル、pートロベンゼンスルホニルのようなアリールスルホニル基を示し、好適には、低級アルキルスルホニル基であり、更に好適には、メタンスルホニルであ

る。

第8工程は、化合物(10)とアミン化合物(11)とを反応させて、脱離基をNR  $^a$  R  $^b$  に変換することによって、本発明の化合物(If)を製造する工程である。本反応は、第5工程と同様にして実施される。

上記A法乃至D法において出発原料となる化合物、すなわち、化合物(1)、(3)、(4)、(5)、(6)、(7)、(9)及び(11)は、それ自体公知の化合物であるか、公知の化合物から、公知の方法に準じて処理することにより、容易に得られる化合物であり、化合物(10)は公知の化合物から、上記A法乃至D法と同様の反応を行うことによって容易に合成することができる。

例えば、化合物(1)については:

Aが、「置換基群 δ で置換されてもよいベンゼン」である化合物は、D.J.P.Pinto et al., Bioorg. Med. Chem. Lett., 6, 2907-2912(1996)、D.J.P.Pinto et al., Bioorg. Med. Chem. Lett., 9, 919-924(1999)、M.B.Norton et al., J. Med. Chem., 39, 1846-1856(1996)、WO 96/10012、WO 96/26921及び WO 96/16934等に準じて合成することができ、

Aが、「置換基群  $\delta$  で置換されてもよいピリジン」である化合物は、R.W.Friesen et al., Bioorg. Med. Chem. Lett., 8, 2777-2782 (1998) 等に準じて合成することができ、

Aが、「置換基群δで置換されてもよいピリダジン」又は「置換基群δで置換されてもよいピリミジン」である化合物は、W0 0031065 等に準じて合成することができ、

Aが、「置換基群  $\delta$  で置換されてもよいピロール」である化合物は、EP 1070711 等に準じて合成することができ、

Aが、「置換基群  $\delta$  で置換されてもよいフラン」である化合物は、USP 6,048,880 等に準じて合成することができ、

Aが、「置換基群 δ で置換されてもよいチオフェン」である化合物は、W0 9426731、Y.Leblanc et al., Bioorg. Med. Chem. Lett., 5, 2123-2128(1995)、S.R.Bertenshaw et al., Bioorg. Med. Chem. Lett., 5, 2919-2922(1995)、D.J.P.Pinto et al., Bioorg. Med. Chem. Lett., 6, 2907-2912(1996)及び W0

9500501 等に準じて合成することができ、

Aが、「置換基群δで置換されてもよいピラゾール」である化合物は、W0 0031063、W0 9958523、W0 0039116及びW0 9531451等に準じて合成することができ、

Aが、「置換基群 & で置換されてもよいイミダゾール」である化合物は、I.K.Khanna et al., J. Med. Chem., 40, 1634-1647(1997)、W0 9314081、W0 9723479、USP 5,716,955、W0 9725046、W0 9725047、W0 9725048、W0 9502591 及び J.L.Adams et al., Bioorg. Med. Chem. Lett., 8, 3111-3116(1998) 等に準じて合成することができ、

Aが、「イソキサゾール」である化合物は、特開 2000-86657 号等に準じて合成することができ、

Aが、「イソチアゾール」である化合物は、₩0 9500501 等に準じて合成することができる。

更に、化合物(3)は、下記〈E法〉乃至〈I法〉にしたがって合成することができ、化合物(5)は、下記〈L法〉にしたがって合成することができる。

(E法)

上記式中、B、L、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>及びmは、前記と同意義を示し、

 $R^7$ 及び $R^8$ は、同一若しくは異なって、前記「低級アルキル基」又は前記「アラルキル基」を示す。ただし、化合物(1.7)及び(1.8)において、8個の  $R^5$ 

のうち、少なくとも5個は水素原子を示す。

第9工程は、環状アミノ酸エステル化合物(12)と、脱離基(L)を有するカルボン酸エステル化合物(13)とを付加させることにより、環状アミンジエステル化合物(14)を製造する工程である。

本反応は、通常、溶媒中、塩基の存在下又は非存在下に行なわれる。

使用される溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノールのようなアルコール類;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類;ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシドのような非プロトン性極性溶媒;アセトニトリルのようなニトリル類;酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;ペンタン、ヘキサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類を挙げることができる。

使用される塩基としては、例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムー t ーブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド類;水素化ナトリウム、水素化リチウムのようなアルカリ金属水素化物;水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物;炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩;トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ピコリン、1,8ージアザビシクロ[5.4.0]-7ーウンデセンのようなアミン類を挙げることができる。

反応温度は、通常、-20℃乃至150℃で行なわれるが、好適には0℃乃至 100℃である。反応時間は、通常、10分間乃至48時間であり、好適には3 0分間乃至12時間である。

次いで、環状アミンジエステル化合物(14)をDieckmann反応(第10工程)に付してケトエステル化合物 [化合物(15)及び/又は化合物(16)]とした後、それぞれの化合物について、加水分解及び脱炭酸反応を行なって、目的の環状アミノケトン化合物 [化合物(17)及び化合物(18)]が製造される(第11工程及び第12工程)。

上記第10工程乃至第12工程において採用される反応は、J.R. Harrison et al., J. Chem. Soc,, Perkin Trans. 1, 1999, 3623-3631 に記載の方法に準じて実

施することができ、第11工程及び第12工程は、例えば、下記のように実施される。

第11工程及び第12工程の反応は、通常、溶媒の存在下もしくは非存在下、 酸又は塩基の存在下若しくは非存在下に実施される。

溶媒としては、水、又は水と有機溶媒(例えば、ペンタン、ヘキサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類;メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、sーブタノール、イソブタノール、tーブタノールのようなアルコール類;N, Nージメチルホルムアミド、N, Nージメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシドのような非プロトン性極性溶媒;アセトニトリルのようなニトリル類;酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類)の混合溶媒を挙げることができる。好適には、水、又は、水とアルコール類若しくはエーテル類の混合溶媒が用いられる。

使用される酸としては、通常の加水分解反応において酸として用いられるものであれば特に限定はなく、例えば、塩酸、硫酸、リン酸などの鉱酸類; ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸のようなカルボン酸類; メタンスルホン酸、エタンスルホン酸のようなスルホン酸類を上げることができる。これらのうち、好適には鉱酸類又はカルボン酸類が用いられ、更に好適には塩酸、硫酸、ギ酸又は酢酸が用いられる。

尚、本反応は酸を加えることにより進行が促進される。

使用される塩基としては、通常の加水分解反応において塩基として用いられるものであれば特に限定はなく、例えば、水素化ナトリウム、水素化リチウムのようなアルカリ金属水素化物;水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物;炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩;トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ピコリン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセンのようなアミン類を挙げることができる。これらのうち、好適にはアルカリ金属水酸化物が用いられ、更に好適には水酸化

ナトリウム又は水酸化カリウムが用いられる。

反応温度は、通常、-20℃乃至150℃で行なわれるが、好適には0℃乃至100℃である。反応時間は、通常、10分間乃至48時間であり、好適には30分間乃至12時間である。

$$H_2N-W$$
  $OR^{11}$  (20)  $OR^{12}$  (20)  $OR^{12}$  (20)  $OR^{12}$  (20)  $OR^{12}$  (20)  $OR^{12}$  (20)  $OR^{12}$  (21)  $OR^{12}$  (21)  $OR^{12}$  (22)  $OR^{10}$   $OR^{12}$   $OR^{$ 

上記式中、R5は、前記と同意義を示し、

 $R^9$ 及び $R^{10}$ は、同一若しくは異なって、前記「低級アルキル基」又は前記「アラルキル基」を示し、

R"及びR"は、同一若しくは異なって、前記「低級アルキル基」を示すか、 又は、R"及びR"は、一緒になって、前記「低級アルキレン基」を示し、

Wは、窒素原子、酸素原子、硫黄原子、基>SO及び基>SO $_2$ からなる群より選択される1又は2個の原子若しくは基で中断されていてもよく、1乃至3個の $R^5$ で置換された低級アルキレン基を示し、

一般式(22)及び(23)における、Wを含有する類式基は、D及びEを含む環B(該Bは、無置換であるか、1乃至3個の $R^5$ を有する)に対応する基を示す。ただし、化合物(23)の4個の $R^5$ のうち、少なくとも1個は、水素原子を示す。

第13工程及び第14工程は、0.Pollet et al., Heterocycles, 43, 1391(19

96)又は Anet et al., Austral. J. scient. Res., <A>3, 635-640 (1950)に詳述されている反応に準じて実施することができる。

上記式中、B、R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>は前記と同意義を示し、

R<sup>13</sup>はアミノ基の保護基を示し、

Halは、ハロゲン原子(好適には、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子)を示し、

Yは、ハロゲノカルボニル基(例えば、-CO-C1、-CO-Br Yは一CO-I)、N-低級アルコキシーN-低級アルキルカルバモイル基(例えば、N-メトキシーN-メチルカルバモイル、N-エトキシーN-メチルカルバモイル、N-エチルーN-メトキシカルバモイル等)、Xはシアノ基を示す。

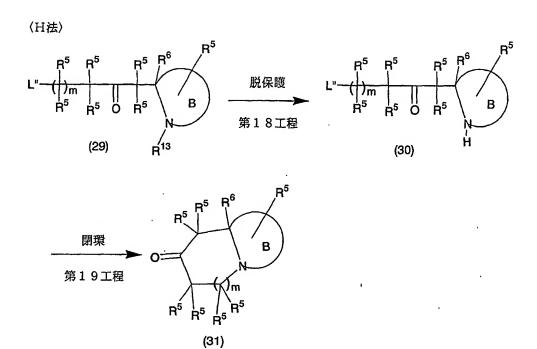
ただし、化合物(28)の6個の $R^5$ のうち、少なくとも3個は、水素原子を示す。

R<sup>13</sup>の定義における「アミノ基の保護基」とは、有機合成において通常用いられるアミノ基の保護基を意味し、そのような基としては、例えば、前記「脂肪族アシル基」、前記「芳香族アシル基」、前記「シリル基」、前記「アラルキル基」、

前記「アルコキシカルボニル基」、前記「アルケニルオキシカルボニル基」、前記 「アラルキルオキシカルボニル基」を挙げることができる。

第15工程は、環状アミノ酸誘導体(24)とオレフィンのグリニアール試薬(25)とを反応させて、 $\alpha$ ,  $\beta$  — 不飽和ケトン体(26)を製造する工程である。本工程においては、カルボン酸誘導体とグリニアール試薬とからケトンを合成する反応として良く知られている反応を採用することができ、例えば、H.R. Snyder et al., Org. Synth., III, 798(1955); J. Cason et al., J. Org. Chem., 26, 1768(1961); G.H. Posner et al., J. Am. Chem. Soc., 94, 5106(1972); 及び G.H. Posner, Org. React., 19, 1(1972)等に詳述されている方法に準じて実施される。

次いで、 $\alpha$ ,  $\beta$ -不飽和ケトン体(26)の窒素原子の保護基( $R^{12}$ )を除去してフリー体(27)とし(第16工程)、得られた化合物を閉環せしめる(第17 7工程)ことにより、目的の環状アミノケトン化合物(28)を製造することができる。第16工程においては、通常有機合成において汎用される脱保護反応(例えば、T.V. Greene et al., Protective Groups in Organic Synthesis, John Willey & Sons, Inc. に記載の反応)を採用することができ、好適には、中性下又は酸性条件下での脱保護反応が採用される。この脱保護反応の後、生成する化合物(27)は直ちに閉環して目的のアミノケトン化合物(28)が生成する。また、第16工程において、酸性条件下で脱保護を行なった場合には、反応液を中和することにより、直ちにアミノケトン化合物(28)が生成する。



上記式中、B、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>13</sup>及びmは前記と同意義を示し、

L"は、Lの定義における脱離基、前記「低級アルキルスルホニル基」、前記「アリールスルホニル基」又はハロゲノ低級アルキルスルホニル基(例えば、トリフルオロメタンスルホニル、ペンタフルオロエタンスルホニル等)を示す。ただし、化合物(31)の9個の $R^5$ のうち、少なくとも6個は、水素原子を示す。

第18工程及び第19工程は、まず、脱離基を有するケトン化合物(29)の保護基(R<sup>12</sup>)を除去して、フリー体(30)を得て、次いでそのフリー体を閉環せしめることにより目的のアミノケトン化合物(31)を製造する工程であり、第16工程及び第17工程と同様に実施される。尚、本法における出発原料である化合物(29)は公知であるか、公知化合物から公知の方法(例えば、S.W. Goldstein et al., J. Org. Chem., 57, 1179-1190(1992)、B. Achille et al., J. Comb. Chem., 2, 337-340(2000)等に記載されている方法)に従って製造することができる。

上記式中、R<sup>6</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>13</sup>及びBは前記と同意義を示し、

R<sup>11</sup>は、水素原子又はカルボキシル基の保護基を示し、

R<sup>16</sup> 及びR<sup>16</sup> は、同一若しくは異なって、それぞれ、水素原子、前記「低級アルキル基」又は前記「アラルキル基」を示すか、或いは、R<sup>15</sup> 及びR<sup>16</sup> は、それらが結合している窒素原子と一緒になって、ピペリジル、ピペラジニル、モルホリニル、チオモルホリニルのような、窒素原子を1個含み、更に、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子を1個含んでいてもよい5又は6員へテロシクリル基を形成する。

ただし、化合物(38)の4個の $R^5$ のうち、少なくとも1個は、水素原子を示す。

R<sup>11</sup>の定義における「カルボキシル基の保護基」とは、有機合成の分野において通常用いられるカルボキシル基の保護基を示し、そのような保護基としては、例えば、前記「低級アルキル基」、前記「低級アルケニル基」、前記「アラルキル基」などを挙げることができ、好適には、前記「低級アルキル基」又は前記「アラルキル基」である。

第20工程及び第21工程は、まず、脱離基を有する $\alpha$ -ケト酸化合物 (32) の保護基 ( $R^{13}$ )を除去して、フリー体 (33)を得て、次いでそのフリー体を閉環せしめることによりケトラクタム化合物 (34)を製造する工程であり、第16工程及び第17工程として述べた方法と同様の方法で実施される。

第22工程は、ケトラクタム化合物(34)と2級アミン化合物(35)とを 反応させて、環状エナミノラクタム化合物(36)を製造する工程である。本工 程においては、有機合成反応の分野で汎用されるエナミン合成法を採用すること ができ、例えば、G. Stork et al., J. Am. Chem. Soc., 85, 207(1963)に記載さ れている方法に従って実施され、例えば、以下のように実施される。

反応は、通常、溶媒中、酸の存在下若しくは非存在下に実施される。

使用される溶媒としては、ペンタン、ヘキサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類;メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、プタノール、sーブタノール、イソプタノール、tーブタノールのようなアルコール類;N,Nージメチルホルムアミド、N,Nージメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシドのような非プロトン性極性溶媒;アセトニトリルのようなニトリル類;酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類を挙げることができる。これらのうち、好適にはエーテル類が用いられる。

使用される酸としては、塩化水素、臭化水素酸、硫酸、過塩素酸、燐酸のような無機酸;及び酢酸、蟻酸、蓚酸、メタンスルホン酸、パラトルエンスルホン酸、トリフルオロ酢酸、トリフルオロメタンスルホン酸のような有機酸を挙げることができ、好適には、硫酸、塩化水素又はパラトルエンスルホン酸が用いられる。

本工程において、モレキュラーシープを添加したり、水分離装置(例えば、Dean Staak Water Separator: Aldrich 社製)を用いて水を除去することにより、生成する水を除去することにより、反応を効率的に実施することができる。

反応温度は、通常、-20℃乃至150℃で行なわれるが、好適には0℃乃至 100℃である。反応時間は、通常、10分間乃至48時間であり、好適には3 0分間乃至12時間である。

第23工程は、環状エナミノラクタム化合物(36)を還元して環状エナミン化合物(37)を製造する工程である。本工程においては、有機合成の分野で汎用されるアミドからアミンを生成する還元反応を採用することができ、S. Cortes et al., J. Org. Chem., 48, 2246(1983); Y. Tsuda et al., Synthesis, 652(1977); H. C. Brown et al., J. Am. Chem. Soc., 86, 3566(1964) 及び R. J. Sundberg et al., J. Org. Chem., 46, 3730(1981) に記載されている方法に従って実施され、例えば、以下のように実施される。

本反応は、通常、溶媒中、還元剤の存在下におこなわれる。

使用される還元剤としては、例えば、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウムのような水素化ホウ素アルカリ金属、水素化アルミニウムリチウム、水素化リチウムトリエトキシドアルミニウムのような水素化アルミニウム化合物のようなヒドリド試薬;塩化アルミニウム、四塩化錫、四塩化チタンのようなルイス酸と前記「ヒドリド試薬」の組合せ;及びジボランのようなホウ素化合物を挙げることができる。これらのうち、好適には水素化アルミニウムリチウムが用いられる。

溶媒としては、非極性溶媒を用いることができ、好適には、ペンタン、ヘキサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類が用いられる。これらのうち、更に好適にはエーテル類が用いられる。

反応温度は、通常、-20℃乃至150℃で行なわれるが、好適には0℃乃至 100℃である。反応時間は、通常、10分間乃至48時間であり、好適には3 0分間乃至12時間である。

第24工程は、環状エナミン化合物(37)を加水分解することにより環状アミノケトン化合物(38)を製造する工程であり、環状エナミン化合物(37)を、溶媒の存在下もしくは非存在下、酸又は塩基の存在下若しくは非存在下に、水に接触させることにより反応が実施される。

溶媒としては、水、又は水と有機溶媒(例えば、ペンタン、ヘキサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類;メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、sーブタノール、イソブタノール、tーブタノールのようなアルコール類;N,Nージメチルホルムアミド、N,Nージメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシドのような非プロトン性極性溶媒;アセトニトリルのようなニトリル類;酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類)の混合溶媒を挙げることができる。これらのうち、好適には水又は水とアルコール類若しくはエーテル類の混合溶媒が用いられる。

使用される酸としては、通常の加水分解反応において酸として用いられるものであれば特に限定はなく、例えば、塩酸、硫酸、リン酸などの鉱酸類; ギ酸、酢酸、プロピオン酸、トリフルオロ酢酸のようなカルボン酸類; メタンスルホン酸、エタンスルホン酸のようなスルホン酸類を上げることができる。尚、本反応は酸を加えることにより進行が促進される。これらのうち、好適には塩酸、硫酸又は酢酸が用いられる。

使用される塩基としては、通常の加水分解反応において塩基として用いられるものであれば特に限定はなく、例えば、水素化ナトリウム、水素化リチウムのようなアルカリ金属水素化物;水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩; トリエチルアミン、トリブチルアミン、ピリジン、ピコリン、1,8ージアザビシクロ[5.4.0]ー7ーウンデセンのようなアミン類を挙げることができる。これらのうち、好適には水酸化ナトリウム又は水酸化カリウムが用いられる。

反応温度は、通常、-20℃乃至150℃で行なわれるが、好適には0℃乃至100℃である。反応時間は、通常、10分間乃至48時間であり、好適には30分間乃至12時間である。

環状アミノケトン化合物 (38)-の製造における中間体である化合物 (36) は、下記 (J法) によって製造することもできる。

上記式中、B、R $^5$ 、R $^6$ 、R $^7$ 、R $^8$ 、R $^{15}$ 及びR $^{16}$ は前記と同意義を示し、R $^{17}$ は、水素原子又はカルボキシル基の保護基を示す。

ただし、化合物(36)の4個の $R^5$ のうち、少なくとも1個は、水素原子を示す。

R<sup>17</sup> の定義における「カルボキシル基の保護基」とは、有機合成において通常 用いられるカルボキシル基の保護基を意味し、そのような基としては、好適には、 前記「低級アルキル基」、前記「アラルキル基」等を挙げることができる。

第25工程は、環状アミノ酸エステル化合物(39)とマロン酸誘導体(40)若しくはその反応性誘導体とを反応させてアミノジエステル化合物(41)を製造する工程である。本工程においては、有機合成の分野で汎用されるアミド化反

応を採用することができ、例えば、下記(a)、(b) 及び(c) のように実施される。

(a) R<sup>11</sup>が水素原子である場合、反応は、溶媒中、縮合剤の存在下、塩基の存在下若しくは非存在下に行なわれる。

使用される溶媒としては、ペンタン、ヘキサン、ヘプタンのような脂肪族炭化水素類;ベンゼン、トルエン、キシレンのような芳香族炭化水素類;ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類;メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、sーブタノール、イソブタノール、tーブタノールのようなアルコール類;N,Nージメチルホルムアミド、N,Nージメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシドのような非プロトン性極性溶媒;アセトニトリルのようなニトリル類;酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類;水;又はそれらの混合溶媒を挙げることができる。これらのうち、好適にはハロゲン化炭化水素、エーテル類又はエステル類が用いられ、更に好適にはジクロロメタン、テトラヒドロフラン又は酢酸エチルが用いられる。

縮合剤としては、例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-エチル-3 -(3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド、又はN, N  $^{\prime}$  -カルボニルジイミダゾールなどを挙げることができる。

使用される塩基としては、例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム-t-ブトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド類;水素化ナトリウム、水素化リチウムのようなアルカリ金属水素化物;水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物;炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩;トリエチルアミン、トリプチルアミン、ピリジン、ピコリン、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセンのようなアミン類を挙げることができる。これらのうち、好適にはアミン類が用いられ、更に好適にはトリエチルアミン、ピリジン又は1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセンが用いられる。

反応温度は、通常、-20℃乃至150℃で行なわれるが、好適には0℃乃至

100℃である。反応時間は、通常、10分間乃至48時間であり、好適には3 0分間乃至12時間である。

また、R<sup>17</sup> が水素原子である場合には、化合物(40)を反応性誘導体に変換した後に、(c)に記載する方法に従って反応を実施することもできる。

(b) R<sup>11</sup> がカルボキシル基の保護基(好適には、前記「低級アルキル基」又は前記「アラルキル基」) である場合、反応は、溶媒の存在下若しくは非存在下に加熱することにより達成される。

溶媒中で反応を行なう場合には、(a)に記載された溶媒と同様の溶媒を用いることができ、反応温度は、30  $\mathbb{C}$   $\mathbb{D}$  至 100  $\mathbb{C}$  であり、好適には、使用される溶媒の沸点の $\pm 5$   $\mathbb{C}$  の範囲であることが好ましい。最適には、反応は、還流下で反応液を加熱することにより実施される。

溶媒を使用しない場合には、化合物(39)と化合物(40)とを混合し、これを加熱することにより反応を実施することができる。反応温度は、30 $^{\circ}$ 乃至150 $^{\circ}$ であり、好適には、50 $^{\circ}$ 乃至120 $^{\circ}$ である。

反応時間は、通常、10分間乃至48時間であり、好適には30分間乃至12時間である。

(c)化合物(40)の反応性誘導体を用いる場合、「反応性誘導体」とは、酸ハロゲン化物、混合酸無水物、活性エステル、活性アミドなどを示し、反応は、溶媒中、縮合剤の存在下、塩基の存在下若しくは非存在下に実施される。

「酸ハロゲン化物」は、R<sup>17</sup>が水素である化合物(40)とハロゲン化剤(例えば、チオニルクロリド、オキサリルクロリドなど)とを反応させることによって得ることができ;「混合酸無水物」は、R<sup>17</sup>が水素である化合物(40)と酸ハロゲン化物(例えば、クロロ炭酸メチル、クロロ炭酸エチルなど)とを反応させることによって得ることができ;「活性エステル」は、R<sup>17</sup>が水素である化合物(40)とヒドロキシ化合物(例えば、Nーヒドロキシコハク酸イミド、Nーヒドロキシフタル酸イミドなど)とを(a)で述べた「縮合剤」の存在下に反応させることによって得ることができ;「活性アミド」(例えば、Weinreb amide)は、R<sup>16</sup>が水素である化合物(40)とNー低級アルコキシーNー低級アルキルヒドロキシアミン(例えば、NーメトキシーNーメチルヒドロキシアミンなど)とを(a)

で述べた「縮合剤」の存在下に反応させることによって得ることができる。いずれも、通常の有機合成化学において汎用される反応条件を適用して実施される。

溶媒、縮合剤及び塩基としては、(a)に記載した溶媒、縮合剤及び塩基を使用することができる。

反応温度は、通常、-20℃乃至150℃で行なわれるが、好適には0℃乃至100℃である。反応時間は、通常、10分間乃至48時間であり、好適には30分間乃至12時間である。

第26工程及び第27工程は、アミドジエステル化合物(41)をDieckman反応に付してケトラクタムエステル化合物(42)を製造し、次いで加水分解及び脱炭酸反応を行なってケトラクタム化合物(43)を製造する工程であり、第10工程及び第11工程と同様に実施される。

第28工程は、ケトラクタム化合物(43)と2級アミン化合物(35)とを 反応させて、環状エナミノラクタム化合物(36)を製造する工程であり、第2 2工程と同様に実施される。

更に、上記〈J法〉における中間体である化合物(42)は、下記〈K法〉によって製造することもできる。

上記式中、B、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>8</sup>及びR<sup>17</sup>は前記と同意義を示す。

ただし、化合物(42)の4個の $R^5$ のうち、少なくとも1個は、水素原子を示す。

第29工程は環状アミノ酸(44)とマロン酸誘導体(40)若しくはその反応性誘導体とを反応させてアミドモノエステル化合物(45)を製造する工程であり、第25工程の(a)、(b)及び(c)と同様に実施される。

第30工程はアミドモノエステル化合物(45)のカルボキシル基と活性メチレン基とを分子内で縮合させて閉環し、ケトラクタムエステル化合物(42)を製造する工程である。本工程においては、化合物(45)をそのまま用いるか、化合物(45)を反応性誘導体に変換して用いられる。

(a)化合物(45)をそのまま用いる場合、反応は、溶媒中、縮合剤の存在下、 塩基の存在下若しくは非存在下に行なわれる。

使用される溶媒としては、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタンなどのハロゲン化炭化水素;ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類;メタノール、エタノール、プロパノール、イソプロパノール、ブタノール、sーブタノール、イソプタノール、tーブタノールのようなアルコール類;N,Nージメチルホルムアミド、N,Nージメチルアセトアミド、ジメチルスルホキシドのような非プロトン性極性溶媒;アセトニトリルのようなニトリル類;酢酸メチル、酢酸エチルのようなエステル類;水;又はそれらの混合溶媒を挙げることができる。これらのうち、好適にはハロゲン化炭化水素、エーテル類又はエステル類が用いられ、更に好適にはジクロロメタン、テトラヒドロフラン又は酢酸エチルが用いられる。

縮合剤としては、例えば、ジシクロヘキシルカルボジイミド、1-エチル-3- (3-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド、又はN, N'-カルボニルジイミダゾールなどを挙げることができる。

使用される塩基としては、例えば、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムー t ープトキシドのようなアルカリ金属アルコキシド類;水素化ナトリウム、水素化リチウムのようなアルカリ金属水素化物;水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物;炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩;トリエチルアミン、トリプチルアミン、ピリジン、ピコリン、1、8ージアザビシクロ[5.4.0]-7ーウンデセンのようなアミン類を挙げることができる。これらのうち、好適にはアミン類が用いられ、更

に好適にはトリエチルアミン、ピリジン又は1, 8 – ジアザビシクロ [5.4.0] – 7 – ウンデセンが用いられる。

反応温度は、通常、-20℃乃至150℃で行なわれるが、好適には0℃乃至100℃である。反応時間は、通常、10分間乃至48時間であり、好適には30分間乃至12時間である。

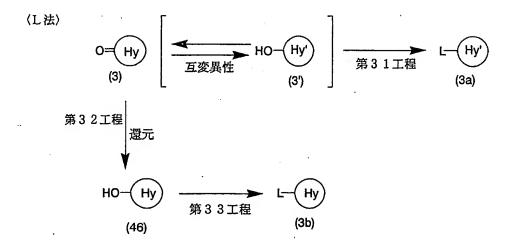
(b) 化合物(45)を反応性誘導体とし、これを用いる場合、反応性誘導体としては、酸ハロゲン化物、混合酸無水物、活性エステル、活性アミドなどを挙げることができる。

酸ハロゲン化物は、化合物(45)とハロゲン化剤(例えば、チオニルクロリド、オキサリルクロリドなど)とを反応させることによって得ることができ;混合酸無水物は、化合物(45)と酸ハロゲン化物(例えば、クロロ炭酸メチル、クロロ炭酸エチルなど)とを反応させることによって得ることができ;活性エステルは、化合物(45)とヒドロキシ化合物(例えば、Nーヒドロキシコハク酸イミド、Nーヒドロキシフタル酸イミドなど)とを(a)で述べた「縮合剤」の存在下に反応させることによって得ることができ;「活性アミド」(例えば、Weinreb amide)は、化合物(45)とNー低級アルコキシーNー低級アルキルヒドロキシアミン(例えば、NーメトキシーNーメチルヒドロキシアミンなど)とを(a)で述べた「縮合剤」の存在下に反応させることによって得ることができる。いずれも、通常の有機合成化学において汎用される反応条件を適用して実施される。

当該反応性誘導体の閉環反応は、通常、溶媒中、塩基の存在下又は非存在下に行なわれる。

溶媒、縮合剤及び塩基としては、(a)に記載した溶媒、縮合剤及び塩基を使用 することができる。

反応温度は、通常、-20℃乃至150℃で行なわれるが、好適には0℃乃至100℃である。反応時間は、通常、10分間乃至48時間であり、好適には30分間乃至12時間である。



上記式中、Hy、Hy、及びLは前記と同意義を示す。

第31工程は、ヘテロシクリルケトン(3)の互変異性体である化合物(3')の水酸基を脱離基に変換して、化合物(3 a)を製造する工程であり、本反応は、化合物(3')と、ハロゲン化剤(例えば、三フッ化ジエチルアミノ硫黄(DAST)のようなフッ素化剤;塩化チオニル、三塩化リン、五塩化リン、オキシ塩化リン、トリフェニルホスフィン/四塩化炭素のような塩化剤;臭化水素酸、臭化チオニル、三臭化リン、トリフェニルホスフィン/四臭化炭素のような臭素化剤;又は、ヨウ化水素酸、三ヨウ化リンのような沃素化剤等)、スルホニルハライド類(例えば、メタンスルホニルクロリド、pートルエンスルホニルクロリド等)又は無水スルホン酸類(例えば、トリフルオロメタンスルホン酸無水物等)とを反応させることにより実施される。

第32工程は、ヘテロシクリルケトン(3)を還元してヘテロシクリルアルコール(46)を製造する工程であり、例えば、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウムのような水素化ホウ素アルカリ金属;水素化アルミニウムリチウム、水素化リチウムトリエトキシドアルミニウムのような水素化アルミニウム化合物;水素化テルルナトリウム;ジイソブチルアルミニウムヒドリド、ジ(メトキシエトキシ)アルミニウムナトリウムジヒドリドのような水素化有機アルミニウム系還元剤等のヒドリド試薬を用いた還元反応、又は水素による接触還元を採用することができ、反応は、例えば、J.Dale、J.Chem.Soc.、910(1961)及び

F.G. Bordwell et al., J.Org. Chem., 33, 3385 (1968) に詳述されている方法にしたがって実施される。

第33工程は、ヘテロシクリルアルコール(46)の水酸基を脱離基に変換して、化合物(3a)を製造する工程であり、第31工程に記載の方法と同様に実施される。

また、一般式(I)の化合物の部分構造である $R^3$ は種々の置換基( $R^5$ )を有し得る。この $R^5$ は上記各工程において別の置換基に変換することができ、例えば、常法に従って下記のように変換することができる。

上記式中、Ra、Rb及びHalは前記と同意義を示し、

 $R^{18}$ は、前記「低級アルキル基」又は前記「ハロゲノ低級アルキル基」「アリール基」又は「置換基群 $\alpha$ 及び置換基群 $\beta$ から選択される基で置換されたアリール基」を示し、

R<sup>19</sup> は、同一若しくは異なって、前記「低級アルキル基」又は前記「ハロゲノ低級アルキル基」を示すか、或いは、2つのR<sup>19</sup> は一緒になって低級アルキレン基を示し、

R<sup>20</sup>は、前記「低級アルキル基」を示し、

R<sup>11</sup>は、水素原子又は前記「低級アルキル基」を示し、

 $R^{22}$  は、置換基群  $\beta$  の定義における、「低級アルキル基」、「低級アルケニル基」、「低級アルキニル基」、「アラルキル基」、「シクロアルキル基」、「置換基群  $\alpha$  から選択される基で置換された低級アルキル基」、「置換基群  $\alpha$  から選択される基で置換された低級アルケニル基」又は「置換基群  $\alpha$  から選択される基で置換されたアルキニル基」、或いは、置換基群  $\gamma$  の定義における、「アリール基」又は「置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたアリール基」を示す。

更に、R<sup>5</sup>が、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基、低級アルキルスルホニル基である場合には、下記のように、二重結合を形成させた後、還元反応を行なうことにより、常法に従って当該置換基を水素原子に置きかえることもできる。

$$R^5$$
  $R^5$ 

上記式中、R<sup>5</sup>は、前記と同意義を示し、R<sup>5</sup>aは、ハロゲン原子、水酸基、シアノ基又は低級アルキルスルホニル基を示す。

R<sup>5</sup>が低級アルキリデニル基又はアラルキリデニル基である化合物は、下記のように、対応するオキソ化合物から製造することができる。更にそれらの化合物をから、対応する低級アルキル置換化合物又はアラルキル置換化合物を製造することができる。

$$R^{23}$$
 $R^{24}$ 
 $R^{24}$ 
 $R^{24}$ 
 $R^{24}$ 

上記式中、R<sup>23</sup>及びR<sup>24</sup>は、同一若しくは異なって、それぞれ水素原子、前記「低級アルキル基」、前記「アリール基」又は前記「アラルキル基」を示す。

上記各反応終了後、目的化合物は常法に従って、反応混合物から採取される。 例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により 除去した後、水と酢酸エチルのような混和しない有機溶媒を加え、水等で洗浄後、 目的化合物を含む有機層を分離し、無水硫酸マグネシウム等で乾燥後、溶剤を留 去することによって得られる。

得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿、又は、通常、有機化合物の分離精製に慣用されている方法、例えば、シリカゲル、アルミナ、マグネシウムーシリカゲル系のフロリジルのような担体を用いた吸着カラムクロマトグラフィー法;セファデックスLH-20(ファルマシア社製)、アンパーライトXAD-11(ローム・アンド・ハース社製)、ダイヤイオンHP-20(三菱化学社製)のような担体を用いた分配カラムクロマトグラフィー等の合成吸着剤を使用する方法、イオン交換クロマトを使用する方法、又は、シリカゲル若しくはアルキル化シリカゲルによる順相・逆相カラムクロマトグラフィー法(好適には、高速液体クロマトグラフィーである。)を適宜組合せ、適切な溶離剤で溶出することによって分離、精製することができる。

本発明の「糖尿病を予防若しくは治療するための医薬組成物」の投与形態としては、例えば錠剤、カプセル剤、顆粒剤、散剤もしくはシロップ剤等による経口投与、または注射剤もしくは座剤等による非経口投与をあげることができる。これらの製剤は、一般式(I)を有する化合物又はその薬理上許容される塩、エステル若しくはその他の誘導体に、賦形剤、滑沢剤、結合剤、崩壊剤、安定剤、矯味矯臭剤、希釈剤などの添加剤を加えて周知の方法で製造される。

ここに、賦形剤は、例えば、乳糖、白糖、ぶどう糖、マンニット、ソルビットのような糖誘導体;トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、αーデンプン、デキストリン、カルボキシメチルデンプンのような澱粉誘導体;結晶セルロース、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、

カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースカルシウム、内部架橋カルボキシメチルセルロースナトリウムのようなセルロース誘導体;アラビアゴム;デキストラン;プルランなどの有機系賦形剤;又は軽質無水珪酸、合成珪酸アルミニウム、メタ珪酸アルミン酸マグネシウムのような珪酸塩誘導体;燐酸カルシウムのような燐酸塩;炭酸カルシウムのような炭酸塩;硫酸カルシウムのような硫酸塩などの無機系賦形剤である。

滑沢剤は、例えば、ステアリン酸、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウムのようなステアリン酸金属塩;タルク;コロイドシリカ;ビーガム、ゲイ蝋のようなワックス類;硼酸:アジピン酸;硫酸ナトリウムのような硫酸塩;グリコール;フマル酸;安息香酸ナトリウム;DLーロイシン;脂肪酸ナトリウム塩;ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリル硫酸マグネシウムのようなラウリル硫酸塩;無水珪酸、珪酸水和物のような珪酸類;又は上記澱粉誘導体である。

結合剤は、例えば、ポリビニルピロリドン、マクロゴール又は前記賦形剤と同様の化合物である。

崩壊剤は、例えば、前記賦形剤と同様の化合物又はクロスカルメロースナトリウム、カルボキシメチルスターチナトリウム、架橋ポリビニルピロリドンのような化学修飾されたデンプン・セルロース類である。

安定剤は、例えば、メチルパラベン、プロピルパラベンのようなパラオキシ安息香酸エステル類;クロロブタノール、ベンジルアルコール、フェニルエチルアルコールのようなアルコール類;塩化ベンザルコニウム;フェノール、クレゾールのようなフェノール類;チメロサール;デヒドロ酢酸;又はソルビン酸である。

矯味矯臭剤は、例えば、通常使用される、甘味料、酸味料、又は香料などである。

一般式(I)を有する化合物又はその薬理上許容される塩、エステル若しくはその他の誘導体の使用量は症状、年齢、投与方法等によって異なるが、例えば経口投与の場合には、それぞれ、成人に対して1日あたり、下限として0.1mg(好ましくは0.5mg)、上限として、2000mg(好ましくは500mg)を1回または数回に分けて、症状に応じて投与することが望ましい。静脈内投与

の場合には、成人に対して1日当たり、下限として0.01mg(好ましくは0.05mg)、上限として、200mg(好ましくは50mg)を1回または数回に分けて、症状に応じて投与することが望ましい。

# [発明を実施するための最良の形態]

以下に、製造例、参考例、製剤例および実施例を挙げて、本発明について更に 具体的に詳述するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

# (製造例1)

- 2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(2R,8aS)-2-3++シ-1,2,3,5,8,8a-4++ にロインドリジン-7-4ル] -3-(ピリジン-4-4ル) -1 H-ピロール (例示化合物番号<math>5-15)
- 1) 4-エトキシカルボニル-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール
- 1. 5 3 Mブチルリチウム/ヘキサン溶液 3 6 m 1 (5 4. 7 mm o 1) をテトラヒドロフラン 2 4 0 m 1 中に加え、次いで-45℃で、α-(p-トルエンスルホニル) -4-フルオロベンジルイソシアニド15. 9 0 g (5 4. 7 mm o 1)のテトラヒドロフラン溶液 1 2 0 m 1を加えた。同温度で 1 0 分間攪拌後、9 5 % リチウムブロミド 2 5. 0 0 g (2 7 3 mm o 1)を加えて 3 0 分間攪拌し、更に 3-(4-ピリジル)アクリル酸 エチルエステル 8. 7 3 g (4 9. 2 mm o 1)のテトラヒドロフラン溶液 1 2 0 m 1を加えた。同温度で 1 時間攪拌後反応器を冷却浴から出して更に 1 時間攪拌し、水 5 0 0 m 1を加えて酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後無水硫酸ナトリウムで乾燥して減圧濃縮し、得られた固形物をジエチルエーテルで洗浄して標記の化合物 1 3. 6 1 g を淡黄色粉末として得た(収率 8 9 %)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ p p m: 8.84 (1H, br.s), 8.51 (2H, d, J=7Hz), 7.58 (1H, d, J=3Hz), 7.21 (2H, d, J=6Hz), 7.11 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 6.97 (2H, t, J=9Hz), 4.18 (2H, quartet, J=7Hz), 1.20 (3H, t, J=7Hz)。 6.47 (1H, t, J=3Hz).

- 2) 2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール
- 1)で得た4-xトキシカルボニルー2-(4-7)ルオロフェニル) -3-(1)リジンー4-7ル) -1 Hーピロール1 5. 0 0 g (4 8. 3 mm o 1) を、酢酸 9 0 m 1、硫酸 3 0 m 1 及び水 6 0 m 1 の混合液に溶解し、1 0 0  $\mathbb C$  で 1 6 時間攪拌した。室温に冷却後、1 0 % 水酸化ナトリウム水溶液を加えてアルカリ性とし、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムで乾燥して減圧濃縮し、標記の化合物 1 1. 4 0 g を微赤色粉末として得た(収率 9 9 %)。

1H-核磁気共鳴スペクトル (500MHz, CDC1<sub>8</sub>) δppm:

- 9.78 (1H, br.s), 8.42 (2H, d, J=7Hz), 7.37 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 7.22 (2H, d, J=6Hz), 7.06 (2H, t, J=9Hz), 6.90 (1H, t, J=3Hz),
- 3) 2-(4-7)ルオロフェニル)-3-(29)ジン-4-7ル)-1-トリイソプロピルシリル-.1 H-ピロール
- 2) で得た2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール11.30g(47.4mmol)をテトラヒドロフラン300mlに溶解し、-78℃で1.57Nプチルリチウム/ヘキサン溶液31ml(47.4mmol)を加えて10分間攪拌した後、同温度で、トリイソプロピルシリルトリフラート13.4ml(49.8mmol)を加えた。更に、反応器を冷却浴から出して室温で30分間攪拌した。反応液に水200mlと飽和炭酸水素ナトリウム水溶液300mlを加えて酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗後、無水硫酸ナトリウムで乾燥して減圧濃縮し、標記の化合物18.70gを赤紫色油状物として得た(収率:定量的)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ p p m: 8.25 (2H, d, J=6Hz), 7.39 (2H, dd, J=9Hz, 6Hz), 7.28 (2H, t, J=9Hz), 7.00 (1H, d, J=3Hz), 6.91(2H, d, J=7Hz), 6.71 (1H, d, J=3Hz), 1.15-1.05 (3H, m), 0.98 (18H, d, J=8Hz)。

4) 4-プロモー 2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジンー 4-イル)-1-トリイソプロピルシリルー 1 H-ピロール

3) で得た 2-(4-7)ルオロフェニル) -3-(2) ピリジン-4-7ル) -1 ートリイソプロピルシリルー 1 Hーピロール 1 8. 7 0 g(4 7. 4 mm o 1)・をテトラヒドロフラン 3 0 0 m 1 に溶解し、-7 8  $\mathbb C$  で、N ープロモコハク酸イミド 8. 6 1 g(4 7. 4 mm o 1)のテトラヒドロフラン懸濁液 1 0 0 m 1 を徐々に加え、同温度で 6 時間攪拌し、更に反応器を冷却浴から出して室温で 1 時間攪拌した後、ヘキサン 4 0 0 m 1 を加えて不溶物を濾去した。濾液を減圧濃縮して残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;ヘキサン:酢酸エチル =2:1)に付し、標記の化合物 9.5 7 gを淡黄色プリズム状結晶として得た(収率 4 3 %)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)δppm: 8.36 (2H, d, J=6Hz), 7.34 (2H, dd, J=9Hz, 6Hz),

- 7.18 (2H, t, J=9Hz), 7.12 (1H, s), 7.04(2H, d, J=6Hz),
- 1.16-1.08 (3H, m), 0.99 (18H, d, J=8Hz).
- 5) 2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(2R,8aS)-2-メトキシー1,2,3,5,8,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール
- 4)で得た4ープロモー2ー(4ーフルオロフェニル)-3ー(ピリジンー4ーイル)-1ートリイソプロピルシリル-1Hーピロール3.00g(6.34mmol)をテトラヒドロフラン60mlに溶解し、-78℃で1.6Mプチルリチウム/ヘキサン溶液4.36ml(6.97mmol)を加えて10分間撹拌した後、同温度で(2R,8aS)-2ーメトキシー1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン-7-オン1.29g(7.60mmol)を加えて-78℃で2時間、室温で1時間撹拌した。反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に加えて酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗して無水硫酸ナトリウムで乾燥した後減圧濃縮した。

残渣をジクロロエタン40mlに溶解し、トリフルオロ酢酸1.95ml(25.3mmol)を加えて1時間加熱還流した後反応液を減圧濃縮した。次いで 残渣をテトラヒドロフラン30mlに溶解し、1Mテトラブチルアンモニウムフ ルオリド/テトラヒドロフラン溶液25.3ml(25.3mmol)を加えて 室温で10分間撹拌した後、反応液に水を加え、1N塩酸水溶液で酸性にして酢酸エチルで抽出した。水層に炭酸ナトリウムを加えてアルカリ性としてから酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗して無水硫酸ナトリウムで乾燥後減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=100:10:1)に付し、標記の化合物(Rf値0.45)を微褐色粉末として得た(収率22%)。

融点:203-205℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ p p m:
11.38 (1H, br. s), 8.44 (2H, d, J=6Hz), 7.20-7.06 (6H, m),
6.90 (1H, d, J=3Hz), 5.27-5.22 (1H, m), 3.92-3.85 (1H, m),
3.40 (1H, dd, J=9Hz, 7Hz), 3.29-3.19 (1H, m), 3.16 (3H, s),
2.71-2.62 (1H, m), 2.37-2.20 (2H, m), 2.04-1.90 (2H, m),
1.88-1.80 (1H, m), 1.51-1.41 (1H, m)。

(製造例2)

2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(2R, 8aS) - 2-メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] <math>-3-(ピリジン-4-イル) -1 H - ピロール(例示化合物番号 2-3 0 3)

製造例1-5)で実施したシルカゲルカラムクロマトグラフィーにより標記の化合物 (Rf値0.40)を微褐色粉末として得た (収率12%)。

融点:198-200℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δppm:

- 11.39 (1H, br.s), 8.44 (2H, d, J=6Hz), 7.21-7.05 (6H, m),
- 6.92 (1H, d, J=3Hz), 5.16-5.11 (1H, m), 3.92-3.84 (1H, m),
- 3.39-3.25 (1H, m), 3.23-3.11 (1H, m), 3.15 (3H, s),
- 3.05 (1H, dd, J=10Hz, 6Hz), 2.86-2.77 (1H, m),
- 2.64-2.54 (1H, m), 2.30-2.19 (1H, m), 2.10-2.00 (1H, m),
- 1.76-1.67 (1H, m), 1.48-1.38 (1H, m).

(製造例3)

(2R,8aS) -2-メトキシ-1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンの代わりに(2R,8aS) -2-(t-プチルジメチルシリルオキシ)-1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンを用いて、製造例1-5)と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン-100:10:2.5)に行ない、標記の化合物(Rf値0.25)を微褐色粉末として得た(収率25%)。

融点:208-210℃ (分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)δppm:

11.37 (1H, br.s), 8.44 (2H, d, J=6Hz), 7.20-7.06 (6H, m),

6.90 (1H, d, J=3Hz), 5.26-5.22 (1H, m), 4.72 (1H, d, J=4Hz),

4.25-4.16 (1H, m), 3.38-3.27 (1H, m), 3.25-3.17 (1H, m),

2.72-2.63 (1H, m), 2.45-2.35 (1H, m), 2.26-2.18 (1H, m),

1.98-1.87 (2H, m), 1.71-1.64 (1H, m), 1.57-1.46 (1H, m).

#### (製造例4)

2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(2R,8aS)-2-Eドロキシー1,2,3,5,6,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール (例示化合物番号2-302)

製造例3で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物 (R f = 0.20) を微褐色粉末として得た (収率9%)。

融点:209-211℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δppm:

11.38 (1H, br.s), 8.44 (2H, d, J=5Hz), 7.20-7.05 (6H, m),

6.90 (1H, d, J=3Hz), 5.16-5.12 (1H, m), 4.63 (1H, d, J=5Hz),

4.25-4.16 (1H, m), 3.30-3.20 (1H, m),

3.00 (1H, dd, J=10Hz, 6Hz), 2.84-2.74 (1H, m),

 $2.63 \cdot 2.53$  (1H, m), 2.40 (1H, dd, J=10Hz, 4Hz).

2.27-2.16 (1H, m), 2.08-1.98 (1H, m), 1.62-1.52 (1H, m), 1.52-1.42 (1H, m).

# (製造例5)

4-[(2S, 8aS)-2-クロロ-1, 2, 3, 5, 8, 8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール(例示化合物番号<math>5-23)

(2R, 8aS) - 2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オク タヒドロインドリジン-7-オンの代わりに(2S, 8aS) - 2 - クロロ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンを用いて、製造例<math>1-5)と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=40:1:1)を行ない、標記の化合物(Rf 値0.45)を微褐色粉末として得た(収率21%)。

融点:195-197℃ (分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 8.46 (2H, d, J=6Hz), 8.38 (1H, br.s), 7.16 (2H, d, J=6Hz),
- 7.13 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 6.97 (2H, t, J=9Hz),
- 6.83 (1H, d, J=3Hz), 5.54-5.53 (1H, m), 4.42-4.36 (1H, m),
- 3.54 (1H, dd, J=16Hz, 5Hz), 3.39 (1H, d, J=11Hz),
- 2.79 (1H, d, J=16Hz), 2.68-2.60 (2H, m), 2.30-2.16 (3H,m),
- 1.85-1.76 (1H, m).

# (製造例6)

4-[(2S,8aS)-2-クロロ-1,2,3,5,6,8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル)-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール(例示化合物番号2-311)

製造例5で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより標記の化合物 (Rf値0.35)を微褐色粉末として得た(収率16%)。

融点:177-180℃(分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 8.49 (2H, d, J=5Hz), 8.37 (1H, br.s), 7.17 (2H, d, J=5Hz), 7.13 (2H, dd, J=8Hz, 5Hz), 6.98 (2H, t, J=8Hz),

6.84 (1H, d, J=3Hz), 5.40 (1H, s), 4.38-4.32 (1H, m),

3.53-3.45 (1H, m), 3.23 (1H, dd, J=11Hz, 7Hz),

3.13-3.06 (2H, m), 2.90-2.82 (1H, m),

2.59 (1H, dt,J=14Hz, 8Hz), 2.43-2.31 (1H, m),

2.13-2.02 (1H, m), 1.79-1.69 (1H, m).

# (製造例7)

 $4-[(8 \text{ a S})-2, 2-ジフルオロ-1, 2, 3, 5, 8, 8 \text{ a}- \land + \forall$ ヒドロインドリジン-7-イル] -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール (例示化合物番号5-26)

(2R, 8aS) - 2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7 - オンの代わりに <math>(8aS) - 2, 2 - ジフルオロ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7 - オンを用いて、製造例<math>1-5) と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;ジクロロメタン:メタノール=49:1)を行ない、標記の化合物(Rf値0.35)を微褐色粉末として得た(収率28%)。

融点:201-203℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)δppm:

11.42 (1H, br.s), 8.45 (2H, d, J=6Hz), 7.21-7.02 (6H, m),

6.93 (1H, d, J=3Hz), 5.27-5.22 (1H, m), 3.48-3.37 (1H, m),

3.33-3.22 (1H, m), 2.77-2.68 (1H, m), 2.59-2.36 (3H, m),

2.34-2.26 (1H, m), 2.16-2.06 (1H, m), 1.96-1.78 (1H, m).

#### (製造例8)

4-[(8aS)-2,2-ジフルオロ-1,2,3,5,6,8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール(例示化合物番号2-314)

製造例7で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより標記の化合物 (Rf値0.30)を微褐色粉末として得た(収率23%)。

融点:202-204℃ (分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)δppm:

11.44 (1H, br.s), 8.43 (2H, d, J=6Hz), 7.21-7.07 (6H, m),

6.96 (1H, d, J=3Hz), 5.15-5.11 (1H, m), 3.46-3.39 (1H, m),

3.26-3.15 (1H, m), 2.98-2.85 (2H, m), 2.71-2.62 (1H, m),

2.39-2.25 (2H, m), 2.12-2.04 (1H, m), 1.83-1.67 (1H, m).

# (製造例9)

(±) -2-(4-7)ルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-7) -4-(6, 9, 9a, 10-テトラヒドロピリド [1, 2-a] インドール-8-イル) <math>-1 H-ピロール (例示化合物番号 6-8)

 $(2R, 8aS) - 2 - \lambda + 2 - 1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a - \lambda 2$  タヒドロインドリジン-  $7 - \lambda 2$  の代わりに  $(\pm) - 6, 7, 8, 9, 9a, 10 - \lambda 2$  の一へキサヒドロピリド [1, 2 - a] インドール-  $8 - \lambda 2$  を用いて、製造例 1 - 5 と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:  $\lambda 2 + \lambda 3$  を行ない、標記の化合物(Rf値0.40)を淡黄色粉末として得た(収率5%)。

融点:214-216℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

8.48 (2H, d, J=6Hz), 8.29 (1H, br.s), 7.18 (2H, d, J=6Hz),

7.14 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 7.11-7.06 (2H, m), 6.98 (2H, t, J=9Hz),

6.87 (1H, d, J=3Hz), 6.69 (1H, t, J=8Hz), 6.46 (1H, d, J=8Hz),

5.62-5.60 (1H, m), 4.00-3.90 (1H, m), 3.47-3.34 (2H, m),

3.03 (1H, dd, J=15Hz, 8Hz), 2.61 (1H, dd, J=15Hz, 12Hz),

2.51-2.33 (2H, m).

#### (製造例10)

(±) -2-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2) ジン-4-7ル)-4-(6,7,9a,10-7) ではいい -3-(2) では、-3-(2) で

製造例9で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより標記の化合物 (Rf値0.20)を淡黄色粉末として得た(収率15%)。

融点:205-207℃ (分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

- 8.32 (2H, d, J=6Hz), 8.27 (1H, br.s), 7.15-7.05 (4H, m),
- 6.95 (2H, t, J=9Hz), 6.88 (2H, d, J=6Hz), 6.77-6.72 (2H, m),
- 6.60 (1H, d, J=8Hz), 5.26 (1H, s), 4.35-4.26 (1H, m),
- 3.77 (1H, dd, J=14Hz, 6Hz), 3.35-3.27 (1H, m),
- 3.13 (1H, dd, J=15Hz, 10Hz), 2.55 (1H, d, 15Hz),
- 2.50-2.39 (1H, m), 1.91-1.82 (1H, m).

#### (製造例11)

2-(4-7)ルオロフェニル)-4-[(2R,8aS)-2-7ェニル-1, 2, 3, 5, 8, 8a-4+サヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール (例示化合物番号5-10)

# 融点:191-193℃ (分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ p p m:

- 11.39 (1H, br.s), 8.46 (2H, d, J=5Hz), 7.38-7.06 (11H, m),
- 6.94 (1H, d, J=2Hz), 5.36-5.29 (1H, m), 3.42-3.27 (2H, m),
- 3.07-2.98 (1H, m), 2.75-2.63 (1H, m), 2.62-2.50 (1H, m),
- 2.46-2.22 (3H, m), 2.16-2.05 (1H, m), 1.40-1.29 (1H, m).

# (製造例12)

2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(2R, 8aS) - 2-7ェニル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-4+サヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール (例示化合物番号2-298)

製造例11で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより標記の化合

物(Rf値0.30)を白色粉末として得た(収率17%)。

融点:208-210℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)δppm:

- 11.40 (1H, br.s), 8.35 (2H, d, J=6Hz), 7.38-7.07 (11H, m),
- 6.95 (1H, d, J=3Hz), 5.25-5.20 (1H, m), 3.49-3.40 (1H, m),
- 3.33-3.21 (1H, m), 3.04-2.90 (2H, m), 2.83-2.69 (2H, m),
- 2.39-2.26 (2H, m), 2.04-1.95 (1H, m), 1.32-1.22 (1H, m).

## (製造例13)

(2R,8aS)-2-メトキシ-1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンの代わりに(8aS)-2,2-エチレンジオキシ-1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンを用いて、製造例<math>1-5)と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=100:10:0.5)を行ない、標記の化合物(Rf値0.55)を白色粉末として得た(収率30%)。

融点:230-232℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ p p m:

- 11.39 (1H, br.s), 8.44 (2H, d, J=6Hz), 7.21-7.06 (6H, m),
- 6.91 (1H, d, J=2Hz), 5.27-5.21 (1H, m), 3.91-3.71 (4H, m),
- 3.27-3.18 (1H, m), 3.12 (1H, d, J=10Hz), 2.68-2.58 (1H, m),
- 2.37-2.16 (3H, m), 2.11-1.97 (2H, m), 1.55 (1H, dd, J=13Hz, 10Hz).

# (製造例14)

製造例13で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより標記の化合

物(Rf値0.40)を淡褐色粉末として得た(収率8%)。

融点:196-198℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δppm:

11.40 (1H, br.s), 8.43 (2H, d, J=6Hz), 7.21-7.05 (6H, m),

6.93 (1H, d, J=3Hz), 5.19-5.14 (1H, m), 3.89-3.72 (4H, m),

3.23-3.14 (1H, m), 2.96-2.85 (2H, m), 2.62-2.48 (2H, m),

2.34-2.21 (1H, m), 2.12-2.01 (1H, m), 1.93 (1H, dd, J=13Hz, 7Hz),

1.51 (1H, dd, J=13Hz, 9Hz).

(製造例15)

融点:190-193℃(分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MH2, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

8.46 (2H, d, J=6Hz), 8.32 (1H, br.s), 7.17 (2H, d, J=6Hz),

7.13 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 6.97 (2H, t, J=9Hz), 6.82 (1H, d, J=3Hz),

5.53-5.51 (1H, m), 3.49-3.43 (1H, m), 2.83 (1H, dd, J=9Hz, 3Hz),

2.82-2.73 (1H, m), 2.41 (1H, t, J=9Hz), 2.30-2.05 (5H, m),

1.09 (3H, d, J=7Hz), 1.06-0.98 (1H, m).

(製造例16)

2-(4-7)ルオロフェニル)-4-[(8aS)-2-3) 3, 5, 6, 8a-4+サヒドロインドリジン-7-7ル)-3-(ピリジン-4-7) 1 -1 H-ピロール(例示化合物番号 2-293)

製造例 15 で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物 (Rf値0.40)を淡褐色粉末として得た(収率10%)。

融点:181-185℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ p p m:

8.47 (2H, d, J=6Hz), 8.30 (1H, br.s), 7.16 (2H, d, J=6Hz),

7.13 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 6.97 (2H, t, J=9Hz), 6.82 (1H, d, J=3Hz),

5.41 (0.2H, s), 5.39 (0.8H, s), 3.53-3.43 (0.8H, m),

3.41-3.22 (0.2H, m), 3.11-3.05 (0.2H, m), 3.04-2.90 (1H, m),

2.89-2.77 (1.6H, m), 2.73-2.64 (0.2H, m), 2.48 (0.8H, t, J=9Hz),

2.41-2.07 (3.2H, m), 2.04-1.93 (1H, m), 1.06 (2.4H, d, J=7Hz),

1.02 (0.6H, d, J=7Hz), 0.99-0.93 (1H, m).

(製造例17)

2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(8aS)-8-4) - 1, 2, 3, 5, 8, 8 a-4 + サヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-4) - 1 H-ピロール (例示化合物番号 5-41)

(2R, 8aS) - 2-メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オク タヒドロインドリジン-7-オンの代わりに (8aS) - 8-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンを用いて製造例1-5) と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー <math>( 溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=10:0.5:0.5) に付し、標記の化合物 (Rf @0.45) を橙色粉末として得た ( 収率5%)。

融点:205-207℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (500MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

8.46 (2H, d, J=8Hz), 8.29-8.18 (1H, br.s), 7.18-7.13 (4H, m),

6.97 (2H, t, J=9Hz), 6.73 (1H, d, J=3Hz), 5.62-5.55 (1H, m),

3.58-3.50 (1H, m), 3.24-3.17 (1H, m), 2.77-2.68 (1H, m),

2.23-2.08 (2H, m), 2.04-1.95 (1H, m), 1.90-1.78 (2H, m),

1.77-1.68 (1H, m), 1.43-1.33 (1H, m), 0.76 (3H, d, J=7Hz).

(製造例18)

2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(8aS)-8-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] <math>-3-(ピリジン-4- イル) -1 H-ピロール (例示化合物番号 2-330)

製造例17で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物 (Rf値0.30)を淡桃色粉末として得た (収率17%)。

融点:233-234℃

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 8.43 (2H, d, J=8Hz). 8.36-8.25 (1H. br.s).

7.22 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 7.08 (2H, d, J=8Hz),

7.00 (2H, t, J=9Hz), 6.70 (1H, d, J=3Hz), 3.07-3.01 (1H, m),

2.97-2.92 (1H, m), 2.91-2.84 (1H, m), 2.70-2.62 (1H, m),

2.57-2.49 (1H, m), 2.34-2.24 (1H, m), 2.12-2.03 (1H, m),

2.02-1.94 (1H, m), 1.92-1.84 (1H, m), 1.81-1.70 (1H, m),

1.55-1.45 (1H, m), 1.46 (3H, s).

# (製造例19)

4-[(8aS)-6-スピロシクロプロパン-1, 2, 3, 5, 6, 8a- キサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール (例示化合物番号2-952)

(2R,8aS)-2-メトキシ-1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンの代わりに4-(8aS)-6-スピロシクロプロパン--1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン]-7-オンを用いて、製造例1-5)と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=100:10:1)を行ない、標記の化合物(Rf値0.24)を淡褐色粉末として得た(収率11%)。

融点:189-191℃ (分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ p p m: 11.35 (1H, br.s), 8.39 (2H, d, J=6Hz), 7.23 (2H, dd, J=9Hz, 6Hz), 7.14 (2H, t, J=9Hz), 7.09 (2H, d, J=6Hz), 6.69 (1H, d, J=2Hz), 383

5.33-5.30 (1H, m), 3.50-3.42 (1H, m), 2.98-2.85 (2H, m),

2.65-2.57 (1H, m), 2.39 (1H, d, J=13Hz), 1.91-1.80 (1H, m),

1.76-1.53 (2H, m), 1.31-1.20 (1H, m), 0.56-0.42 (3H, m),

0.22-0.15 (1H, m).

(製造例20)

2-(4-7)ルオロフェニル)-4-[(2S,8aS)-2-3)トキシー1、2、3、5、8、8 a-4+サヒドロインドリジン-7-71、-3-(ピリジン-4-7)1、-1Hーピロール(例示化合物番号5-15)

(2R, 8aS) - 2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オク タヒドロインドリジン-7-オンの代わりに (2S, 8aS) - 2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンを用いて、製造例<math>1-5) と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=100:10:1) を行ない、標記の化合物(Rf 値0.50)を白色粉末として得た(収率6%)。

融点:212-213℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (500MHz, CDC1<sub>3</sub>) δppm:

8.46.(2H. d. J=6Hz), 8.38-8.27(1H. br.s), 7.16(2H. d. J=6Hz),

7.12 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 6.97 (2H, t, J=9Hz), 6.81 (1H, d, J=3Hz),

5.52-5.47 (1H, m), 3.91-3.84 (1H, m), 3.54-3.47 (1H, m),

3.30-3.24 (1H, m), 3.27 (3H, s), 2.78-2.69 (1H, m),

2.35 (1H, quint, J=7Hz), 2.27-2.10 (4H, m), 1.48-1.39 (1H, m).

(製造例21)

2-(4-7)ルオロフェニル)-4-[(2S, 8aS)-2-4)+2-1, 2, 3, 5, 6, 8a-4 (ピリジン-4-4) -1 Hーピロール(例示化合物番号 2-303)

製造例 20 で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物 (Rf 値 0.30) を微褐色粉末として得た (収率 5%)。

融点:219-220℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (500MHz, CDC1<sub>3</sub>) δppm:

- 8.47 (2H, d, J=6Hz), 8.41-8.30 (1H, br.s), 7.17 (2H, d, J=6Hz),
- 7.12 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 6.97 (2H, t, J=9Hz), 6.82 (1H, d, J=3Hz),
- 5.45.5.41 (1H, m), 4.01.3.93 (1H, m), 3.30 (3H, s),
- 3.28-3.17 (1H, br.s), 3.10-3.03 (1H, m), 2.95 (1H, dd, J=10Hz, 4Hz),
- 2.87-2.78 (1H, m), 2.75-2.65 (1H, m), 2.45-2.35 (1H, m),
- 2.30-2.21 (1H, m), 2.17-2.07 (1H, m), 1.51-1.41 (1H, m).

# (製造例22)

(2R, 8aS) - 2 - メトキシ - 1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a - オクタヒドロインドリジン - 7 - オンの代わりに(8aS) - 2 - メチリデン - 1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a - オクタヒドロインドリジン - 7 - オンを用いて、製造例 <math>1 - 5)と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン = 10:1:1)を行ない、標記の化合物(Rf値0.50)を淡桃色粉末として得た(収率 10%)。

融点:212-214℃(分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

- 8.47 (2H, d, J=6Hz), 8.29 (1H, br.s), 7.17 (2H, d, J=6Hz),
- 7.13 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 6.97 (2H, t, J=9Hz),
- 6.83 (1H, d, J=3Hz), 5.52-5.48 (1H, m), 4.92 (1H, br.s),
- 4.89 (1H, br.s), 3.79 (1H, d, J=13Hz), 3.54-3.43 (1H, m),
- 2.92-2.80 (2H, m), 2.59 (1H, dd, J=16Hz, 6Hz), 2.50-2.38 (1H, m),
- 2.33-2.25 (1H, m), 2.24-2.10 (2H, m).

#### (製造例23)

- 3, 5, 6,  $8a-\Lambda$ キサヒドロインドリジン-7-イル] -3- (ピリジン-
- 4-イル)-1H-ピロール (例示化合物番号2-982)

製造例22で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化

合物 (Rf値0.30)を白色粉末として得た (収率11%)。

融点:217-218℃ (分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 8.46 (2H, d, J=6Hz), 8.29 (1H, br.s), 7.20-7.09 (4H, m),
- 6.97 (2H, t, J=9Hz), 6.83 (1H, d, J=3Hz), 5.42 (1H, d, J=2Hz),
- 4.953 (1H, br.s), 4.949 (1H, br.s), 3.50-3.32 (3H, m),
- 2.99-2.93 (1H, m), 2.80-2.72 (1H, m), 2.56 (1H, dd, J=16Hz, 7Hz),
- 2.42-2.31 (1H, m), 2.22-2.10 (2H, m).

# (製造例24)

- (±) -4-(2, 2-ジフェニル-1, 2, 3, 5, 8, 8a-へキサヒド ロインドリジン-7-(4-7)-2-(4-7)-3-(2)-3-(2) (ピリジン-4-(4)-1) -1 H-2 ロール (例示化合物番号5-56)

融点:224-227℃ (分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δppm:

- 11.39 (1H, br.s), 8.44 (2H, d, J=5Hz), 7.33-7.07 (16H, m),
- 6.93 (1H, d, J=3Hz), 5.34-5.29 (1H, m), 3.85 (1H, d, J=9Hz),
- 3.42-3.32 (1H, m), 2.86 (1H, dd, J=13Hz, 7Hz), 2.75-2.65 (2H, m),
- 2.49-2.39 (1H, m), 2.33-2.24 (1H, m), 2.16-2.03 (2H, m).

#### (製造例25)

製造例24で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化

合物(Rf値0.30)を淡褐色粉末として得た(収率15%)。

融点:241-244℃ (分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δppm:

11.38 (1H, br.s), 8.21 (2H, d, J=6Hz), 7.36-7.28 (4H, m),

7.25-7.08 (10H, m), 7.02 (2H, d, J=6Hz), 6.91 (1H, d, J=3Hz),

5.24-5.21 (1H, m), 3.62-3.55 (1H, m), 3.53-3.47 (1H, m),

3.17 (1H, d, J=6Hz), 2.94-2.75 (3H, m), 2.35-2.24 (1H, m),

1.97-1.87 (1H, m), 1.75 (1H, dd, 13Hz, 8Hz).

#### (製造例 2 6)

4-[(8aS)-2,2-ジメチル-1,2,3,5,8,8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール (例示化合物番号<math>5-13)

 $(2R, 8aS) - 2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7 - オンの代わりに <math>(8aS) - 2, 2 - ジメチル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a - オクタヒドロインドリジン-7 - オンを用いて、製造例1-5) と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=100:10:1) を行ない、標記の化合物 <math>(Rf \ 60.50)$  を淡褐色粉末として得た (収率32%)。

融点:193-196℃ (分解)

 $^{1}$ H-核磁気共鳴スペクトル( $400\,\mathrm{MHz}$ , DMSO- $\mathrm{d_6}$ )  $\delta\,\mathrm{ppm}$ :

11.37 (1H, br.s), 8.44 (2H, d, J=6Hz), 7.19-7.07 (6H, m),

6.90 (1H, d, J=3Hz), 5.27-5.22 (1H, m), 3.27-3.18 (1H, m),

2.78 (1H, d, J=9Hz), 2.64-2.54 (1H, m), 2.33-2.15 (2H, m),

2.06-1.94 (1H, m), 1.93-1.85 (1H, m), 1.67 (1H, dd, J=12Hz, 7Hz),

1.21-1.12 (1H, m), 1.07 (3H, s), 1.02 (3H, s).

#### (製造例27)

4-[(8aS)-2,2-ジメチル-1,2,3,5,6,8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル)-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール(例示化合物番号2-301)

製造例26で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物 (Rf値0.25)を淡褐色粉末として得た(収率18%)。

融点:190-193℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δppm:

11.38 (1H, br.s), 8.43 (2H, d, J=6Hz), 7.20-7.08 (6H, m),

6.91 (1H, d, J=3Hz), 5.15-5.11 (1H, m), 3.28-3.19 (1H, m),

2.95-2.86 (1H, m), 2.66-2.55 (2H, m), 2.36-2.21 (2H, m),

2.00-1.92 (1H, m), 1.56 (1H, dd, J=12Hz, 7Hz), 1.10-0.98 (1H, m),

1.05 (3H, s), 1.02 (3H, s).

(製造例28)

2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(2S,8aS)-2-メチルチオ-1,2,3,5,8,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] <math>-3-(ピリジン-4-7) -1 H-ピロール (例示化合物番号 5-63)

(2R, 8aS) - 2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7 - オンの代わりに <math>(2S, 8aS) - 2 - メチルチオ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7 - オンを用いて、製造例<math>1-5)と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=100:1:1)を行ない、標記の化合物 (Rf@0.25)を淡褐色粉末として得た (収率17%)。

融点:212-213℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CD<sub>3</sub>OD) δppm:

8.35 (2H, dd, J=5Hz, 1Hz), 7.24 (2H, dd, J=5Hz, 1Hz),

7.20-7.15 (2H, m), 7.03-6.98 (2H, m), 6.85 (1H, s),

5.38 (1H, t, J=2Hz), 3.43-3.37 (1H, m), 3.31-3.24 (1H, m),

3.15 (1H, dd, J=10Hz, 3Hz), 2.82-2.77 (1H, m),

2.63 (1H, dd, J=10Hz, 9Hz), 2.49-2.30 (3H, m),

2.27-2.13 (1H, m), 2.10 (3H, s), 1.37-1.29 (1H, m).

(製造例29)

2, 3, 5, 6, 8 a - ヘキサヒドロインドリジン- 7 - イル] - 3 - (ピリジン- 4 - イル) - 1 H - ピロール (例示化合物番号 2 - 9 9 5)

製造例28で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物(Rf値0.10)を淡褐色粉末として得た(収率12%)。

融点:198-200℃ (分解)

 $^{1}$ H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CD $_{3}$ OD) $\delta$ ppm:

- 8.38 (2H, dd, J=4Hz, 1Hz), 7.24 (2H, dd, J=4Hz, 1Hz),
- 7.20-7.15 (2H, m), 7.03-6.97 (2H, m), 6.86 (1H, s),
- 5.28 (1H, d, J=2Hz), 3.53-3.48 (1H, m), 3.25 (1H, quintet, J=8Hz),
- 3.14 (1H, dd, J=10Hz, 8Hz), 3.08-3.03 (1H, m), 2.87-2.78 (2H, m),
- 2.40 (1H, ddd, J=13hz, 8Hz, 3Hz), 2.36-2.30 (1H, m),
- 2.17-2.16 (1H, m), 2.14 (3H, s), 1.36 (1H, ddd, J=13Hz, 8Hz, 3Hz)。 (製造例 3 0)

2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(8aS)-2-メチル-3,5,8,8a-テトラヒドロインドリジン-7-イル] <math>-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール (例示化合物番号7-1)

(2R, 8aS) - 2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オク タヒドロインドリジン-7 - オンの代わりに(8aS) - 2 - メチル-3, 5,

- 6, 7, 8, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-7-オンを用いて、製造例1-
- 5) と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=10:1:1)を行ない、標記の化合物(Rf値0.50)を淡褐色粉末として得た(収率3%)。

融点:183-185℃(分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 8.48 (2H, d, J=6Hz), 8.37 (1H, br.s), 7.20-7.09 (4H, m),
- 6.97 (2H, t, J=9Hz), 6.83 (1H, d, J=3Hz), 5.58-5.50 (1H, m),
- 5.38-5.32 (1H, m), 3.71-3.32 (4H, m), 3.30-3.20 (1H, m),
- 2.50-2.28 (2H, m), 1.79 (3H, m),

(製造例31)

2-(4-7)ルオロフェニル)-4-[(8aS)-2-メチル-3,5,6,8a-テトラヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール(例示化合物番号4-1)

製造例 30 で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物 (Rf 値 0.30) を淡褐色粉末として得た (収率 5%)。

融点:181-183℃ (分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

- 8.45 (2H, d, J=6Hz), 8.37 (1H, br.s), 7.20-7.09 (4H, m),
- 6.97 (2H, t, J=9Hz), 6.81 (1H, d, J=3Hz), 5.44 (1H, br.s),
- 5.24 (1H, br.s), 4.42-4.38 (1H, m), 3.60-3.44 (2H, m),
- 3.04-2.92 (2H, m), 2.40-2.28 (1H, m), 1.97-1.85 (1H, m),
- 1.75 (3H, s).

(製造例32)

 $4-[(2S,8aS)-2-エチル-1,2,3,5,6,8a-\Lambdaキサヒドロインドリジン-7-イル)-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール (例示化合物番号2-294)$ 

融点:203-205℃ (分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 11.39-11.38 (1H, br.s), 8.43 (2H, d, J=6Hz), 7.19-7.16 (2H, m),
- 7.15-7.10 (4H, m), 6.91 (1H, d, J=3Hz), 5.13-5.12 (1H, br.s),
- 3.32-3.26 (2H, m), 2.94-2.90 (1H, m), 2.70-2.64 (2H, m),
- 2.50-2.41 (1H, m), 2.31-2.25 (1H, m), 2.02-1.88 (3H, m),
- 1.38-1.28 (2H, m), 0.85 (3H, t, J=7Hz).

(製造例33)

 $4-[(2S,8aS)-2-プチルチオ-1,2,3,5,8,8a-\Lambda+サヒドロインドリジン-7-イル)-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール (例示化合物番号<math>5-66$ )

 $(2R, 8aS) - 2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7 - オンの代わりに <math>(2S, 8aS) - 2 - プチルチオ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7 - オンを用いて、製造例1-5) と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶媒;酢酸エチル: メタノール: イソプロピルアミン=100:1:1) を行ない、標記の化合物 <math>(Rf \ 60.25)$  を淡桃色粉末として得た (収率8%)。

融点:189-190℃ (分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CD<sub>3</sub>OD) δppm:

8.35 (2H, dd, J=5Hz, 2Hz), 7.24 (2H, dd, J=5Hz, 2Hz),

7.15 (2H, dd, J=5Hz, 3Hz), 7.03-6.97 (2H, m), 6.85 (1H, s),

5.37 (1H, t, J=2Hz), 3.42-3.33 (2H, m), 3.13 (1H, dd, J=10Hz, 3Hz),

2.83-2.77 (1H, m), 2.66 (1H, t, J=10Hz), 2.56 (2H, t, J=7Hz),

2.53-2.30 (3H, m), 2.21-2.13 (1H, m), 1.57 (2H, quintet, J=8Hz),

1.42 (2H, sextet, J=7Hz), 1.36-1.29 (1H, m), 0.92 (3H, t, J=7Hz).

(製造例34)

 $4-[(2S,8aS)-2-プチルチオー1,2,3,5,6,8a-\wedge$ キサヒドロインドリジン-7-イル)-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール(例示化合物番号2-998)

製造例33で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物(Rf値0.10)を淡褐色粉末として得た(収率13%)。

融点:199-200℃ (分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CD<sub>3</sub>OD) δppm:

8.37 (2H, dd, J=5Hz, 2Hz), 7.23 (2H, dd, J=5Hz, 2Hz),

7.17 (2H, dd, J=6Hz, 3Hz), 7.03-6.97 (2H, m), 6.86 (1H, s),

5.26 (1H, d, J=1Hz), 3.53-3.49 (1H, m), 3.14 (1H, dd, J=10Hz, 8Hz),

3.08-3.03 (1H, m), 2.88-2.76 (2H, m), 2.59 (2H, t, J=7Hz), 2.44-2.29 (2H, m), 2.16-2.11 (1H, m), 1.59 (2H, tt, J=16Hz, 7Hz), 1.44 (2H, sextet, J=7Hz), 1.35 (2H, tt, J=13Hz, 8Hz), 1.24 (3H, t, J=7Hz).

(製造例35)

 $4-[(2S,8aS)-2-xチルチオ-1,2,3,5,8,8a-\wedge+サヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール (例示化合物番号<math>5-64$ )

融点:205-207℃(分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CD<sub>3</sub>OD)δppm:

8.35 (2H, dd, J=4Hz, 1Hz), 7.23 (2H, dd, J=4Hz, 1Hz),

7.19-7.15 (2H, m), 7.03-6.97 (2H, m), 6.85 (1H, s),

5.38 (1H, t, J=2Hz), 3.42-3.33 (2H, m), 3.13 (1H, dd, J=10Hz, 3Hz),

2.83-2.77 (1H, m), 2.66 (1H, dd, J=10Hz, 8Hz), 2.57 (2H, q, J=7Hz),

2.50-2.33 (2H, m), 2.31-2.30 (1H, m), 2.21-2.13 (1H, m),

1.38-1.30 (1H, m), 1.25 (3H, t, J=7Hz).

(製造例36)

4-[(2S,8aS)-2-エチルチオ-1,2,3,5,6,8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール (例示化合物番号2-996)

製造例 35 で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物 (Rf 値 0.10) を淡桃色粉末として得た (収率 20%)。

融点:193-196℃(分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ p p m:

8.37 (2H, dd, J=4Hz, 2Hz), 7.23 (2H, dd, J=4Hz, 2Hz),

7.21-7.15 (2H, m), 7.02-6.98 (2H, m), 6.86 (1H, s),

5.27 (1H, br.s), 3.54-3.49 (1H, m), 3.32 (1H, quintet, J=8Hz),

3.14 (1H, dd, J=10Hz, 8Hz), 3.08-3.02 (1H, dt, J=12Hz, 5Hz),

2.85 (1H, dt, J=12Hz, 5Hz), 2.78 (1H, dd, J=10Hz, 8Hz),

2.60 (2H, q, J=8Hz), 2.41 (1H, dt, J=12Hz, 9Hz),

2.36-2.29 (1H, m), 2.17-2.11 (1H, m), 1.35 (1H, dt, J=13Hz, 8Hz),

1.27 (3H, t, J=8Hz).

#### (製造例37)

 $(2R, 8aS) - 2 - \lambda トキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンの代わりに(8aS)-2 - エチリデン-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンを用いて、製造例1-5)と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=100:5:3)を行ない、標記の化合物(Rf値0.50)を白色粉末として得た(収率4%)。$ 

融点:244-246℃ (分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

8.42 (2H, d, J=6Hz), 7.18-7.12 (4H, m), 7.10-7.07 (2H, m),

6.93 (1H, d, J=3Hz), 5.31-5.29 (1H, br.s), 5.18-5.16 (1H, br.s),

3.30-3.29 (1H, m), 3.24-3.23 (1H, m), 3.19-3.10 (1H, m),

2.84-2.80 (1H, m), 2.64-2.55 (1H, m), 2.35-2.26 (2H, m),

2.10-2.07 (1H, m), 1.82-1.78 (1H, m), 1.53 (3H, d, J=6Hz).

# (製造例38)

(ピリジンー4ーイル)、-1H-ピロール(例示化合物番号5-57)

融点:164-166℃ (分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δppm:

- 11.39 (1H, br.s), 8.45 (2H, d, J=6Hz), 7.20-7.08 (6H, m),
- 6.91 (1H, d, J=3Hz), 5.27-5.22 (1H, m), 3.86-3.69 (4H, m),
- 3.39 (1H, d, J=10Hz), 3.27-3.19 (1H, m), 2.66-2.57 (1H, m),
- 2.35-2.19 (3H, m), 2.15 (1H, d, J=10Hz), 2.06-1.96 (1H, m),
- 1.62-1.54 (2H, m), 1.50-1.42 (1H, m).

#### (製造例39)

2-(4-7)ルオロフェニル)-4-[(8aS)-2,2-7ロピレンジオキシー1,2,3,5,6,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール (例示化合物番号2-989)

製造例38で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物(Rf値0.22)を淡褐色粉末として得た(収率19%)。

融点:214-216℃ (分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δppm:

- 11.40 (1H, br.s), 8.43 (2H, d, J=6Hz), 7.22-7.07 (6H, m),
- 6.93 (1H, d, J=3Hz), 5.20-5.16 (1H, m), 3.85-3.70 (4H, m),
- 3.14-3.04 (1H, m), 3.07 (1H, d, J=10Hz), 2.93-2.85 (1H, m),
- 2.62 (1H, d, J=10Hz), 2.54-2.44 (1H, m), 2.33-2.21 (1H, m),
- 2.16-2.04 (2H, m), 1.68-1.44 (2H, m), 1.47 (1H, dd, J=13Hz, 9Hz)。 (製造例40)

4-[(8aS)-2,2-(2',2'-ジメチルプロピレンジオキシ)-1,2,3,5,8,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール(例示化合物番号5-58)

 $(2R, 8aS) - 2 - \lambda + 2 - 1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a - \lambda - 2$  タヒドロインドリジン- 7 - オンの代わりに (8aS) - 2, 2 - (2', 2' - 2') ジメチルプロピレンジオキシ)  $-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a - \lambda - 2$  ドロインドリジン- 7 - オンを用いて、製造例 1 - 5 ) と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン= 100:10:0.25)を行ない、標記の化合物(Rf値0.58)を淡褐色粉末として得た(収率 26%)。

融点:235-237℃ (分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δppm:

- 11.39 (1H, br.s), 8.45 (2H, d, J=6Hz), 7.20-7.08 (6H, m),
- 6.91 (1H, d, J=3Hz), 5.27-5.22 (1H, m), 3.47-3.30 (5H, m),
- 3.26-3.18 (1H, m), 2.66-2.58 (1H, m), 2.36-2.19 (3H, m),
- 2.16 (1H, d, J=10Hz), 2.07-1.96 (1H, m),
- 1.47 (1H, dd, J=12Hz, 10Hz), 0.88 (6H, s).

(製造例41)

4-[(8aS)-2,2-(2',2'-ジメチルプロピレンジオキシ)-1,2,3,5,6,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール(例示化合物番号2-990)

製造例 40 で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物 (Rf値0.20)を白色粉末として得た (収率19%)。

融点:235-237℃ (分解)

 $^{1}$ H -核磁気共鳴スペクトル(400MHz, DMSO-d。)  $\delta$ ppm:11.40 (1H, br.s), 8.43 (2H, d, J=6Hz), 7.19-7.08 (6H, m),

6.93 (1H, d, J=3Hz), 5.19·5.15 (1H, m), 3.47-3.29 (4H, m),

3.14-3.05 (2H, m), 2.93-2.85 (1H, m), 2.63 (1H, d, J=10Hz),

2.54-2.45 (1H, m), 2.33-2.22 (1H, m), 2.14-2.04 (2H, m),

1.46 (1H, dd, J=13Hz, 9Hz), 0.91 (3H, s), 0.85 (3H, s).

(製造例42)

2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(2S, 8aS) - 2-7]ロピルー1, 2, 3, 5, 8, 8 a-4 サヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-7) ン-4-イル) -1 H-ピロール (例示化合物番号 5-7)

(2R, 8aS) - 2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a - オクタヒドロインドリジン-7 - オンの代わりに <math>(2S, 8aS) - 2 - プロピル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a - オクタヒドロインドリジン-7 - オンを用いて、製造例 <math>1-5)と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=100:5:1)を行ない、標記の化合物(Rf値0.60)を淡黄色粉末として得た(収率5%)。

融点:205-206℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDC1<sub>3</sub>) δppm:

11.36-11.35 (1H, br.s), 8.44 (2H, d, J=6Hz), 7.17-7.14 (4H, m),

7.13-7.09 (2H, m), 6.90 (1H, d, J=3Hz), 5.25-5.24 (1H, br.s),

3.36-3.30 (1H, m), 3.27-3.22 (1H, m), 2.74-2.72 (1H, m),

2.61-2.51 (1H, m), 2.23-2.10 (3H, m), 2.07-1.97 (3H, m),

1.38-1.20 (4H, m), 0.86 (3H, t, J=7Hz).

(製造例43)

2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(2S, 8aS) - 2-7]ロピルー1, 2, 3, 5, 6, 8a-4 サヒドロインドリジン-7-4ル] -3-(ピリジン-4-4) -1 Hーピロール (例示化合物番号 2-295)

製造例42で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物 (Rf 値0.50)を淡黄色粉末として得た (収率3%)。

融点:202-203℃(分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 11.38-11.37 (1H, br.s), 8.42 (2H, d, J=6Hz), 7.18-7.13 (4H, m),

7.12-7.09 (2H, m), 6.91 (1H, d, J=3Hz), 5.12-5.11 (1H, br.s),

3.31-3.23 (1H, m), 2.92-2.88 (1H, m), 2.67-2.61 (2H, m),

2.51-2.49 (1H, m), 2.42-2.38 (1H, m), 2.30-2.25 (1H, m),

2.02-1.89 (3H, m), 1.36-1.22 (4H, m), 0.88 (3H, d, J=7Hz).

## (製造例44)

 $4-[(2R, 8aS)-2-Xトキシ-1, 2, 3, 5, 8, 8a-\wedgeキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール (例示化合物番号<math>5-16$ )

(2R, 8aS) - 2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7 - オンの代わりに <math>(2R, 8aS) - 2 - x トキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7 - オンを用いて、製造例1-5) と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=10:1:1)を行ない、標記の化合物(Rf値0.65)を淡褐色粉末として得た(収率9%)。

融点:194-196℃ (分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDC1<sub>3</sub>) δppm:

8.46 (2H, d, J=6Hz), 8.23 (1H, br.s), 7.16 (2H, d, J=6Hz),

7.12 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 6.97 (2H, t, J=9Hz), 6.82 (1H, d, J=3Hz),

5.51-5.47 (1H, m), 4.14-4.08 (1H, m), 3.62-3.53 (1H, m),

3.50-3.36 (3H, m), 2.93-2.82 (1H, m), 2.59-2.46 (1H, m),

2.32-2.15 (2H, m), 2.14-2.01 (1H, m), 2.00-1.92 (1H, m),

1.70-1.60 (1H, m), 1.19 (3H, t, J=7Hz).

### (製造例45)

4-[(2R, 8aS)-2-Xトキシー1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジンー7-4ル] -2-(4-7)ルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-4) -1 H-ピロール (例示化合物番号2-304)

製造例 44 で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物 (Rf 値 0. 60) を淡褐色粉末として得た (収率 7%)。

融点:192-195℃ (分解)

 $^{1}H$  - 核磁気共鳴スペクトル(400 MHz, CDC  $^{1}$  3)  $^{\delta}$  p p m:

- 8.47 (2H, d, J=6Hz), 8.25 (1H, br.s), 7.20-7.09 (4H, m),
- 6.97 (2H. t. J=9Hz), 6.82 (1H. d. J=3Hz), 5.40 (1H, d. J=2Hz),
- 4.10-4.02 (1H, m), 3.50-3.34 (3H, m), 3.16 (1H, dd, J=11Hz, 6Hz),
- 2.99-2.90 (1H, m), 2.80-2.65 (2H, m), 2.46-2.30 (1H, m),
- 2.18-2.04 (1H, m), 1.96-1.88 (1H, m), 1.69-1.60 (1H, m),
- 1.19 (3H, t, J=7Hz).

## (製造例46)

(±) -4-(2-スピロシクロペンタン-1, 2, 3, 5, 8, 8a-ヘキ サヒドロインドリジン-7-イル) -2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール(例示化合物番号 5-6 1)

(2R, 8aS) - 2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オク タヒドロインドリジン-7-オンの代わりに  $(\pm)$  - 2 - スピロシクロペンタン - 1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンを 用いて、製造例 1-5) と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=100:10:0.25) を行ない、標記の化合物 (Rf @ 0.53) を淡褐色粉末として得た (収率 2.9%)。

## 融点:206-208℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)δppm:

- 11.37 (1H, br.s), 8.45 (2H, d, J=5Hz), 7.20-7.07 (6H, m),
- 6.90 (1H, d, J=3Hz), 5.27-5.22 (1H, m), 3.28-3.20 (1H, m),
- 2.90 (1H, d, J=9Hz), 2.64-2.55 (1H, m), 2.29-2.17 (2H, m),
- 2.05-1.94 (2H, m), 1.80 (1H, dd, J=12Hz, 6Hz), 1.64-1.42 (8H, m),
- 1.26 (1H, dd, J=12Hz, 10Hz).

#### (製造例47)

(±) -4-(2-スピロシクロペンタン-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキ サヒドロインドリジン-7-イル) -2-(4-フルオロフエニル) -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール (例示化合物番号 2-993)

製造例46で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化

合物(Rf値0.19)を淡褐色粉末として得た(収率19%)。

融点:202-204℃(分解)

 $^{1}H$  - 核磁気共鳴スペクトル(400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$ ppm:

11.38 (1H, br.s), 8.43 (2H, d, J=6Hz), 7.20-7.08 (6H, m),

6.91 (1H, d, J=3Hz), 5.17-5.13 (1H, m), 3.25-3.18 (1H, m).

2.92-2.85 (1H, m), 2.70 (1H, d, J=9Hz), 2.65-2.56 (1H, m),

2.37 (1H, d, J=9Hz), 2.34-2.23 (1H, m), 2.01-1.92 (1H, m),

1.69 (1H, dd, J=12Hz, 7Hz), 1.61-1.39 (8H, m),

1.15 (1H, dd, J=12Hz, 8Hz).

# (製造例48)

4-[(2S,8aS)-2-ベンジル-1,2,3,5,6,8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール (例示化合物番号 <math>2-299)

(2R, 8aS) - 2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンの代わりに <math>(2S, 8aS) - 2 - ベンジル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンを用いて、製造例<math>1-5) と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=100:10:2) を行ない、標記の化合物(Rf値0.50) を淡褐色粉末として得た(収率11%)。

融点:207-209℃ (分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

11.39-11.38 (1H, br.s), 8.46 (2H, d, J=6Hz), 7.28 (2H, t, J=8Hz),

7.20-7.11 (9H, m), 6.92 (1H, d, J=3Hz), 5.14-5.13 (1H, br.s),

3.39-3.21 (2H, m), 2.91-2.83 (1H, m), 2.65-2.49 (5H, m),

2.32-2.29 (2H, m), 1.99-1.87 (2H, m).

## (製造例49)

4-[(8aS)-2-ベンジリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8a-へキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1H-ピロール (例示化合物番号2-987)

(2R,8aS)-2-メトキシ-1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンの代わりに(8aS)-2-ペンジリデン-1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンを用いて、製造例1-5)と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=100:10:2)を行ない、標記の化合物(Rf値0.50)を淡褐色粉末として得た(収率3%)。

融点:243-245℃ (分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

- 8.41 (2H, d, J=6Hz), 8.31-8.29 (1H, br.s), 7.38-7.27 (4H, m),
- 7.21 (1H, t, J=7Hz), 7.15-7.10 (4H, m), 6.97 (2H, t, J=9Hz),
- 6.84 (1H, d, J=3Hz), 6.40 (1H, s), 5.50-5.49 (1H, br.s)
- 3.65-3.58 (3H, m), 2.96-2.93 (1H, m), 2.85-2.78 (2H, m),
- 2.47-2.42 (1H, m), 2.36-2.21 (2H, m).

(製造例50)

2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(2S,8aS)-2-7ェノキシ-1, 2, 3, 5, 8, 8a-4+サヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール (例示化合物番号 5-68)

(2R, 8aS) - 2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7 - オンの代わりに <math>(2S, 8aS) - 2 - 7x -1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7 - オンを用いて、製造例 <math>1-5) と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶媒;酢酸エチル:メタノール=19:1) を行ない、標記の化合物 (Rf値0.63) を白色粉末として得た(収率33%)。

融点:212-214℃ (分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δppm: 11.40 (1H, br.s), 8.45 (2H, d, J=6Hz), 7.27 (2H, t, J=8Hz), 7.21-7.08 (6H, m), 6.96-6.82 (4H, m), 5.28-5.24 (1H, m), 4.88-4.80 (1H, m), 3.34-3.27 (1H, m), 3.19-3.11 (1H, m), 2.70-2.50 (2H, m), 2.46-2.05 (4H, m), 1.47-1.37 (1H, m)。

(製造例51)

2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(2S,8aS)-2-7ェノキシー1,2,3,5,6,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-4) -1 H-ピロール (例示化合物番号2-1000)

製造例 50 で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物 (R f 値 0.10) を淡褐色粉末として得た (収率15%)。

融点:199-201℃ (分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)δppm:

11.41 (1H, br.s), 8.33 (2H, d, J=6Hz), 7.29 (2H, t, J=8Hz),

7.21-7.08 (6H, m), 6.97-6.86 (4H, m), 5.28-5.24 (1H, m),

4.88-4.82 (1H, m), 3.21-3.14 (1H, m), 3.04-2.91 (3H, m),

2.67-2.57 (1H, m), 2.44-2.35 (1H, m), 2.33-2.23 (1H, m),

2.11-2.02 (1H, m), 1.44-1.36 (1H, m).

(製造例52)

2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(2S,8aS)-2-メチルスルホニル-1,2,3,5,8,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-イル) <math>-1 H-ピロール (例示化合物番号 5-67)

(2R, 8aS) - 2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7 - オンの代わりに <math>(2S, 8aS) - 2 - メチルスルホニル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7 - オンを用いて、製造例<math>1-5)と同様の反応とシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=100:1:1)を行ない、標記の化合物(Rf 60.2)を褐色粉末として得た(収率2%)。

融点:>250℃(分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CD<sub>3</sub>OD) δppm:

8.40-8.36 (2H, m), 7.25 (2H, d, J=5Hz), 7.22-7.15 (2H, m),

7.05-6.98 (2H, m), 6.87 (1H, s), 5.39 (1H, t, J=2Hz),

3.81-3.74 (1H, m), 3.59 (1H, dd, J=11Hz, 3Hz), 3.49-3.44 (1H, m),

2.93 (3H, s), 2.90-2.83 (1H, m), 2.67 (1H, t, J=11Hz),

2.57-2.27 (3H, m), 2.27-2.20 (1H, m), 1.88-1.80 (1H, m).

(製造例53)

2-(4-7)ルオロフェニル)-4-[(2S,8aS)-2-3+1)ルー1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3-(ピリジン-4-7)ルー1H-ピロール(例示化合物番号2-999)

製造例52で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物 (Rf値0.05)を褐色粉末として得た (収率2%)。

融点:147-150℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CD<sub>3</sub>OD)δppm:

8.39-8.35 (2H, m), 7.24 (2H, d, J=5Hz), 7.19-7.16 (2H, m),

7.03-6.87 (2H, m), 6.86 (1H, s), 5.38 (1H, t, J=2Hz),

3.69-3.65 (1H, m), 3.62-3.56 (1H, m), 3.44-3.38 (1H, m),

2.92 (3H, s), 2.82-2.78 (1H, m), 2.63-2.53 (1H, m),

2.50-2.39 (1H, m), 2.36-2.15 (3H, m), 1.92-1.76 (1H, m).

(製造例54)

2-(4-7)ルオロフェニル) -4-[(8aS)-2-7ロピリデン-1,2,3,5,6,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -3-(ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール (例示化合物番号 2-9 8 4 )

# 異性体A

R f 値 0.50、橙色粉末 0.56g(収率4%)、

融点:185-187℃(分解)

 $^1$ H -核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ ppm: 11.41-11.40 (1H, Br.s), 8.41 (2H, d, J=6Hz), 7.18-7.11 (4H, m),

7.10-7.07 (2H, m), 6.93 (1H, d, J=3Hz), 5.23-5.18 (1H, m), 5.14-5.13 (1H, br.s), 3.41-3.36 (1H, m), 3.22-3.13 (2H, m), 2.93-2.89 (1H, m), 2.68-2.66 (1H, m), 2.40-2.29 (2H, m), 2.10-2.06 (1H, m), 1.97-1.87 (2H, m), 1.57-1.55 (1H, m), 0.94 (3H, d, J=7Hz).

## 異性体B

R f值 0.45、白色粉末 1.58g (収率11%)、

融点:249-251℃ (分解)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

11.47·11.46 (1H, Br.s), 8.42 (2H, d, J=6Hz), 7.19·7.14 (4H, m),

7.13-7.07 (2H, m), 6.92 (1H, d, J=3Hz), 5.27-5.23 (1H, m),

5.18-5.17 (1H, br.s), 4.14 (1H, q, J=5Hz), 3.24-3.21 (1H, m),

3.13-3.10 (1H, m), 2.85-2.80 (1H, m), 2.63-2.58 (1H, m),

2.37-2.31 (2H, m), 2.11-2.07 (1H, m), 1.95-1.90 (2H, m),

1.88-1.78 (1H, m), 0.92 (3H, d, J=8Hz).

#### (製造例 5 5)

- $(\pm)$  -4-(4-7)ルオロフェニル)-5-(ピリジン-4-イル)-1-(1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a-オクタヒドロインドリジン-7-イル)イミダゾール(例示化合物番号 20-15)
- 1) (±) -7-アミノ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒド ロインドリジン
- (±)-1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン-7-オン5.0g(35.9mmo1)を2Mアンモニア/エタノール溶液54m1(アンモニアとして108mmo1)に溶解し、10%パラジウムー炭素500mgを加えて、水素雰囲気下、室温で4時間撹拌した。反応液を口過し、口液を減圧濃縮して標記の化合物4.91gを無色油状物として得た(収率98%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

3.15-3.04 (2H, m), 2.72-2.64 (1H, m), 2.10-2.00 (3H, m),

1.91-1.49 (6H, m), 1.47-1.33 (3H,m), 1.06-0.99 (1H, m).

- 2) (±)-7-(ピリジン-4-イル)メチレンアミノ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン
- 1)で得た(±)-7-アミノ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタ ヒドロインドリジン4. 9 1 g (3 5. 0 mm o 1)をトルエン9 5 m 1 に溶解 し、4-ホルミルピリジン3. 3 4 m 1 (3 5. 0 mm o 1)と無水硫酸マグネ シウム3. 7 5 g (3 1. 2 mm o 1)を加えて70℃で3時間撹拌した。反応 液を口過し、口液を減圧濃縮して標記の化合物8. 0 8 gを淡黄色油状物として 得た(収率:定量的)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>8</sub>)δppm: 8.90 (2H, d, J=6Hz), 8.32 (1H, s), 7.71 (2H, d, J=6Hz), 3.15-3.02 (3H, m), 2.71-2.62 (1H, m), 2.18-1.34 (9H, m), 1.08-0.98 (1H, m)。

3) (±) -4-(4-7)ルオロフェニル) -5-(2) ジン-4-7ル) -1-(1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン<math>-7-7 イル) イミダゾール

 $\alpha-(p-h)$ ルエンスルホニル)-4-7ルオロベンジルイソシアニド10.1g(34.9 mmo1)と2)で得た( $\pm$ )-7-(4-ピリジルメチレンアミノ)-1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン8.0g(34.9 mmo1)をジクロロメタン150 m1に溶解し、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン5.22 m1(34.9 mmo1)を加えて室温で2時間撹拌した。反応混合物を減圧濃縮し、残渣に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=20:1:1)に付し、標記の化合物1.87gを淡黄色粉末として得た(収率14%)。

融点:187-189℃

 $^{1}$ H - 核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 8.73 (2H, d, J=3Hz), 7.78 (1H, s), 7.35 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 7.24 (2H, d, J=3Hz), 6.92 (2H, t, J=9Hz), 3.82-3.73 (1H, m),

- 3.18-3.14 (1H, m), 3.08-3.05 (1H, m), 2.18-1.96 (5H, m),
- 1.90-1.82 (3H, m), 1.77-1.71 (2H, m), 1.53-1.44 (1H, m).

(製造例56)

- (±) -5-(4-7)ルオロフェニル) -3-(7-1) にはいまいます。 -5-(4-7) にはいまれる -3-(7-1) にはいます。 -4-7 にはいます。 -4-7 にはいます。 -4-7 にはいます。 -4-7 にはいます。 -4-7 にはいます。 -4-7 にはいます。 -3-7 にはいます。 -3-
- 1) 3-プロモー5-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール
- 5-(4-7)ルオロフェニル)-4-(2)ピリジン-4-7ル)ピラゾール(WO 00/31063)6.0 g (25 mm o 1)をジメチルホルムアミド 60 m 1 に溶解し、N-ブロモコハク酸イミド 8.93 g (50 mm o 1)を加えて室温で 3 日間撹拌した。反応液に水を加え、析出した結晶を口取してジエチルエーテルで洗浄し、標記の化合物 5.73 g を白色粉末として得た(収率 72%)。
- <sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDC1<sub>8</sub>-DMSO-d<sub>6</sub>)δpp m:
- 8.56 (2H, d, J=5Hz), 7.33 (2H, dd, J=8Hz, 5Hz).
- 7.24 (2H, d, J=5Hz), 7.05 (2H, t, J=8Hz).
- 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール
- 1) で得た 3 ープロモー 5 ー (4 ーフルオロフェニル) ー 4 ー (ピリジンー 4 ーイル) ピラゾール 3. 18g (10 mmol) をテトラヒドロフラン 32 mlに溶解し、- 78℃で1.6 Mプチルリチウム/ヘキサン溶液13.75 ml(13.75 mmol)を加えて10分間撹拌した後、同温度で1,2,3,5,6,7,8,8 a ーオクタヒドロインドリジンー7ーオン1.5 3g(11 mmol)を加えて- 78℃で2時間攪拌し、更に室温で1時間撹拌した。反応液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に加えて酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗して無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン= 20:1:1)

に付し標記の化合物830mgを淡黄色粉末として得た(収率22%)。

融点:180-181℃

1.84-1.65 (6H, m), 1.36-1.30 (1H, m).

1H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 8.57 (2H, d, J=6Hz), 7.23 (2H, d, J=6Hz), 7.19 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 6.94 (2H, t, J=9Hz), 3.04-2.99 (1H, m), 2.96-2.90 (1H, m), 2.42-2.36 (1H, m), 2.31-2.24 (1H, m), 2.28-1.99 (3H, m),

## (製造例57)

( $\pm$ ) -5-(4-7)ルオロフェニル) -3-(1, 2, 3, 5, 8, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-(1)0 -4-(1)0 (例示化合物番号14-1)

製造例56の化合物720mg(1.90mmo1)を濃塩酸14mlに溶解し、8時間加熱還流して1N水酸化ナトリウム水溶液で中和した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗し無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=10:1:1)に付し、標記の化合物(Rf値0.45)255mgを白色粉末として得た(収率37%)。

融点:225-230℃

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>8</sub>)δppm:

- 8.54 (2H, d, J=6Hz), 7.29 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 7.15 (2H, d, J=6Hz),
- 6.99 (2H, t, J=9Hz), 5.90 (1H, s), 3.64-3.59 (1H, m),
- 3.28-3.24 (1H, m), 2.90-2.85 (1H, m), 2.40-2.35 (1H, m),
- 2.28-2.15 (3H, m), 2.02-1.89 (2H, m), 1.82-1.75 (1H, m),
- 1.49-1.41 (1H, m).

#### (製造例58)

製造例57で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより標記の化合

物(Rf値0.30)を淡黄色粉末として得た(収率27%)。

融点:204-208℃

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDC1<sub>3</sub>)δppm:

8.54 (2H, d, J=6Hz), 7.28 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 7.15 (2H, d, J=6Hz),

7.00 (2H, t, J=9Hz), 5.87 (1H, s), 3.32-3.26 (1H, m),

3.02-2.98 (1H, m), 2.92-2.88 (1H, m), 2.78-2.68 (2H, m),

2.46-2.38 (1H, m), 2.23-2.17 (1H, m), 2.01-1.74 (3H, m),

1.50-1.41 (1H, m).

## (製造例59)

製造例 57 の化合物 50 m g (0.14 mm o 1) をメタノール 4 m 1 に溶解 し、10% 水酸化パラジウムー炭素 40 m g を加えて水素雰囲気下 50%で 4 時間撹拌した。反応液を口過し、口液を減圧濃縮した。得られた残渣をジエチルエーテルで洗浄し、標記の化合物 27 m g を白色粉末として得た(収率 53%)。

融点:242-243℃

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 8.59 (2H, d, J=6Hz), 7.31 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz),
- 7.11 (2H, d, J=6Hz), 6.99 (2H, t, J=9Hz), 3.23-3.18 (1H, m),
- 3.15-3.08 (1H, m), 2.88-2.79 (1H, m), 2.17-1.42 (11H, m).

#### (製造例60)

- (S) 5 (4 7)ルオロフェニル) -3 (1, 2, 3, 5, 8, 8a 7) ヘキサヒドロインドリジン-7 7 ーイル) -4 (ピリジン<math>-4 7 ーイル) ピラゾール (例示化合物番号 14-1)

ラフィー (溶媒; 酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=10:1:1) に付して、標記の化合物 (R f 値 0.45) 980 m g を淡黄色粉末として得た (収率 6%)。

融点:209-214℃

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ p.p.m: 13.40-13.10 (1H, br.s), 8.52 (2H, m), 7.28 (2H, m),

7.24-7.16 (4H, m), 5.79-5.50 (1H, br.s), 3.44-3.29 (2H, m),

3.05 (1H, m), 2.72-2.62 (1H, br.s), 2.51-1.90 (4H, m),

1.73-1.64 (2H, m), 1.34-1.25 (1H, m).

## (製造例61)

(S) -5-(4-フルオロフェニル) -3-(1, 2, 3, 5, 6, 8 a - ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール (例示化合物番号8-307)

製造例 60 で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物 (Rf  $\pm 60$ . 30) 830 m g を淡黄色粉末として得た (収率 5%)。

融点:198-202℃

 ${}^{1}$ H -核磁気共鳴スペクトル(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)  $\delta$ ppm:

13.23 (1H, br.s), 8.52-8.51 (2H, m), 7.31-7.27 (2H, m),

7.19-7.14 (4H, m), 5.63-5.62 (1H, br.s), 3.17-3.16 (1H, br.s),

2.93-2.87 (1H, m), 2.80-2.74 (1H, m), 2.68-2.61 (1H, m),

2.57-2.50 (1H, m), 2.38-2.33 (1H, m), 2.16-2.08 (1H, m),

1.85-1.57 (3H, m), 1.28-1.19 (1H, br.s).

#### (製造例62)

- 1) 5-エトキシカルボニル-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)チオフェン

ジメチルホルムアミド17.04ml (220mmol)に、氷冷攪拌下で、

オキシ塩化リン7.9ml(85mmol)を滴下し、室温で1時間攪拌した。この溶液を、1-(4-フルオロフェニル)-2-(ピリジン-4-イル)エタノン [T.F.Gallagher et al., Bioorg.Med.Chem., 5, 49-64(1997)] 21.5g(100mmol)をジメチルホルムアミド140mlとジクロロメタン280mlの混合液に溶かした溶液に氷冷攪拌下で滴下し、50℃で2時間攪拌した。反応液を室温にまで冷却後、水を加え、更に6N水酸化ナトリウムを加えてpHを9乃至10に調整し、ジクロロメタンで抽出した。有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、残渣をジクロロエタン100mlとピリジン15mlの混合液に溶解してチオ酢酸エチルエステル11ml(100mmol)を加え、氷冷攪拌下でトリエチルアミン25ml(180mmol)を加えた。室温で1時間攪拌し、次いで80℃で3時間攪拌した後、反応液を室温にまで冷却し、水とジクロロメタンを加えて分液した。有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=2:3)に付して標記の化合物18.11gを褐色粘性油状物として得た(収率55%)。

 $^{1}$ H - 核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl $_{3}$ ) δ p p m: 8.54 (2H, d, J=6Hz), 7.85 (1H, s), 7.28 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 7.14 (2H, d, J=6Hz), 7.04 (2H, t, J=9Hz), 4.39 (2H, q, J=7Hz), 1.40 (2H, t, J=7Hz)。

- 2) 5-カルボキシ-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル) チオフェン
- 1)で得た5-エトキシカルボニル-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル) チオフェン15.17g(46.3mmo1) をエタノール150mlに溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液93ml(93mmo1)を加えて100℃で30分間攪拌した。エタノールを減圧留去して、得られた残渣に水を加え、1N塩酸93mlを加えて析出する結晶を濾取し、標記の化合物12.64gを淡褐色粉末として得た(収率91%)。

 $^1$ H -核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl  $_3$ )  $\delta$ ppm: 8.52 (2H, d, J=6Hz), 7.90 (1H, s), 7.38 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz),

7.26 (2H, t, J=9Hz), 7.25 (2H, d, J=6Hz).

- 3) 2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)チオフェン
- 2) で得た5-カルボキシー2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) チオフェン12.64g(42.2mmol)にキノリン42mlと銅粉2.95g(46.4mmol)を加えて240℃で2.5時間攪拌し、室温にまで冷却した後、濾過し、濾液に酢酸エチルと飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、分液した。有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=1:1)に付して標記の化合物11.81gを褐色粉末として得た(収率:定量的)。

 $^{1}$ H - 核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ ppm:8.58-8.43 (2H, m), 7.38 (1H, d, J=5Hz), 7.26 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 7.19 (1H, d, J=5Hz), 7.16 (2H, d, J=6Hz), 7.01 (2H, t, J=9Hz)。

- 4) 4,5-ジプロモー2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)チオフェン
- 3) で得た2-(4-フルオロフェニル) -3-(ピリジン-4-イル) チオフェン10.70g(41.9mmol)を酢酸100mlに溶解し、臭素8.6ml(167.6mmol)を加えて60℃で5時間攪拌した。室温にまで冷却した後、反応液に28%アンモニア水溶液を加えて塩基性とし、酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=5:2) に付して標記の化合物14.29gを淡褐色粉末として得た(収率83%)。 1H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz,CDCl3)δppm:
- 8.61 (2H, d, J=6Hz), 7.15 (2H, d, J=6Hz),
- 7.09 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 6.95 (2H, t, J=9Hz).
- 5) 4-プロモー2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)チオフェン
  - 4) で得た4、5-ジプロモー2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジ

ンー4ーイル)チオフェン13.88g(33.6mmol)をテトラヒドロフラン140mlに溶解し、-78℃で1.59Mプチルリチウム/ヘキサン溶液23.3ml(37mmol)を滴下した。同温度で15分間攪拌し、水24mlを加えて室温に戻した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液と酢酸エチルを加えて分液し、有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、残渣(固形物)をジエチルエーテルで洗浄して標記の化合物11.20gを淡褐色粉末として得た(収率;定量的)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 8.60 (2H, d, J=6Hz), 7.39 (1H, s), 7.16 (2H, d, J=6Hz), 7.13 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 6.95 (2H, t, J=9Hz)。

- 6) (S)-2-(4-フルオロフェニル)-4-(1, 2, 3, 5, 8, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル)-3-(ピリジン-4-イル)チ
  オフェン
- 3-プロモー5-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジンー4-イル)ピラゾールの代わりに5)で得た4-プロモー2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)チオフェンを、( $\pm$ ) -1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a-オクタヒドロインドリジンー7-オンの代わりに(S) -1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a-オクタヒドロインドリジンー7-オンを用いて製造例5 6-2)と同様の反応を行ない、次いで、得られた生成物を製造例5 7 と同様の脱水反応及びシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=10:10:11)に付して、標記の化合物(Rf値0.50)263mgを褐色非晶性固体として得た(収率23%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル (500MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

- 8.50 (2H, d, J=6Hz), 7.24 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz),
- 7.15 (2H, d, J=6Hz), 7.02 (1H, s), 6.99 (2H, t, J=9Hz),
- 6.20-6.16 (1H, m), 3.73-3.66 (1H, m), 3.25 (1H, dt, J=8Hz, 2Hz),
- 3.00-2.92 (1H, m), 2.77-2.68 (1H, m), 2.42-2.28 (2H, m),
- 2.22 (1H, dd, J=18Hz, 9Hz), 2.14-2.03 (1H, m),
- 1.98-1.88 (1H, m), 1.86-1.77 (1H, m), 1.63-1.50 (1H, m).

## (製造例63)

(S) -2-(4-7)ルオロフェニル) -4-(1, 2, 3, 5, 6, 8a- ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -3-(ピリジン-4-イル) チオフェン (例示化合物番号 18-1)

製造例62で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物(Rf値0.40)307mgを褐色非晶性固体として得た(収率27%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル (500MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

8.50 (2H, d, J=6Hz), 7.24 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz), 7.15 (2H, d, J=6Hz),

7.03 (1H, s), 6.99 (2H, t, J=9Hz), 6.20-6.17 (1H, m),

3.43-3.37 (1H, m), 3.16 (1H, ddd, J=12Hz, 5Hz, 2Hz),

2.99-2.92 (1H, m), 2.86 (1H, ddd, J=18Hz, 7Hz, 5Hz),

2.74-2.63 (2H, m), 2.48-2.39 (1H, m), 2.12-2.03 (1H, m),

1.96-1.77 (2H, m), 1.66-1.55 (1H, m).

### (製造例64)

- $(S) 5 (4 クロロフェニル) 3 (1, 2, 3, 5, 8, 8a \Lambda)$ キサヒドロインドリジン-7 - 4ル) -4 - (ピリジン<math>-4 - 4ル) ピラゾール (例示化合物番号 14 - 503)
- 1) 5-(4-クロロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1-(2 -トリメチルシリルエトキシ)メチルピラゾール

55%水素化ナトリウム1.41g(32.1mmol)をテトラヒドロフラン300mlに懸濁し、5-(4-クロロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール8.21g(32.1mmol)を加えて室温で1時間攪拌した後、水冷攪拌下に(2-トリメチルシリルエトキシ)メチルクロリド5.68ml(32.1mmol)を滴下し、室温で一夜攪拌した。反応液に水を加えた後、酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=3:1)に付して標記の化合物11.12gを淡褐色油状物として得た(収率90%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル (500MHz, CDC1<sub>3</sub>) δppm:

- 8.45 (2H, d, J=6Hz), 7.79 (1H, s), 7.42 (2H, d, J=8Hz),
- 7.34 (2H, d, J=8Hz), 7.07 (2H, d, J=6Hz), 5.31 (2H, s),
- 3.69 (2H, t, J=8Hz), 0.94 (2H, t, J=8Hz), 0.00 (9H, s).
- 2) (S) -5-(4-クロロフェニル) -3-(1, 2, 3, 5, 8, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール

3-プロモー5-(4-フルオロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾールの代わりに1)で得た<math>5-(4-クロロフェニル)-4-(ピリジン-4-イル)-1-(2-トリメチルシリルエトキシ)メチルピラゾールを、(±)-1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンの代わりに(S)-1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンを用いて製造例<math>56-2)と同様の反応を行ない、次いで、得られた生成物を製造例57と同様の脱水反応及びシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール:イソプロピルアミン=10:1:1)に付して、標記の化合物(Rf値0.50)357mgを淡褐色粉末として得た(収率4%)。

融点:211-212℃

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 8.54 (2H, d, J=6Hz), 7.26 (4H, s), 7.15 (2H, d, J=6Hz),
- 5.98-5.86 (1H, m), 3.67-3.57 (1H, m), 3.33-3.23 (1H, m),
- 2.97·2.87 (1H, m), 2.40·2.08 (4H, m), 2.06·1.93 (2H, m).
- 1.86-1.72 (1H, m), 1.53-1.40 (1H, m).

#### (製造例65)

 $(S)-5-(4-\rho \Box \Box \Box \Box \Box \Box D)-3-(1, 2, 3, 5, 6, 8a-$  キサヒドロインドリジン-7- イル)-4-(ピリジン-4- イル) ピラゾール (例示化合物番号8-1652)

製造例 64 で実施したシリカゲルカラムクロマトグラフィーにより、標記の化合物 (Rf値0.20) 454 mgを淡褐色粉末として得た (収率 5%)。

融点:180-181℃

413

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

8.54 (2H, d, J=6Hz), 7.26 (4H, s), 7.15 (2H, d, J=6Hz),

5.95.5.85 (1H, m), 3.33.3.28 (1H, m), 3.00.2.90 (2H, m),

2.81-2.71 (2H, m), 2.40-2.30 (1H, m), 2.44-2.14 (1H, m),

2.03-1.86 (2H, m), 1.85:1.74 (1H, m), 1.54-1.44 (1H, m).

## (製造例66)

5-(4-7)ルオロフェニル) $-3-[(8aS)-2-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda+サヒドロインドリジン-7-イル]-4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール(例示化合物番号<math>8-312$ )

融点:173-175℃(分解)

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDC1<sub>3</sub>) δ p p m:

8.54 (2H, d, J=6Hz), 7.28 (2H, dd, J=9Hz, 5Hz),

7.15 (2H, d, J=6Hz), 7.00 (2H, t, J=9Hz), 5.82 (1H, s),

3.60-3.48 (1H, m), 3.07-2.98 (1H, m), 2.96-2.80 (2H, m),

2.49-2.00 (5H, m), 1.10-1.00 (1H, m), 1.07 (3H, d, J=7Hz).

#### (参考例1)

(2R, 8aS) - 2-メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オク タヒドロインドリジン-7-オン

1) (2S, 4R) -1-ベンジルオキシカルボニル-2-シアノメチル-4 -メトキシピロリジン

(2S, 4R) -1-ベンジルオキシカルボニル-4-メトキシプロリン2.00g(7.16mmol)をテトラヒドロフラン20mlに溶解し、0℃で撹

拌して1Mボラン・テトラヒドロフランコンプレックス/テトラヒドロフラン溶液17.9ml(17.9mmol)を加え、同温度で1時間、更に室温で3時間撹拌した。再び反応液を0  $\infty$  に冷却し、注意深くメタノールを加えた後、減圧濃縮した。残渣に飽和炭酸水素ナトリウムを加え、酢酸エチルで抽出して有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮して褐色油状物1.82g を得た(還元生成物;アルコール体)。

この油状物をジクロロメタン25m1に溶解してトリエチルアミン1.13m1(8.14mmo1)を加え、氷冷撹拌下にメタンスルホニルクロリド0.58m1(7.46mmo1)を加えて同温度で30分間撹拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えた後、ジクロロメタンで抽出して有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後減圧濃縮して褐色油状物2.19gを得た(メシレート体)。

次いでこのものをジメチルスルホキシド 22m1 に溶解してシアン化ナトリウム 0.31g(6.32mmo1) を加え、100 でで 30 分間撹拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗して無水硫酸ナトリウムで乾燥後減圧濃縮し、標記の化合物 1.70g を微褐色油状物として得た(収率 88%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 7.43-7.28 (5H, m), 5.26-5.08 (2H, m), 4.20-4.10 (1H, m),
- 4.03-3.93 (1H, m), 3.90 (0.4H, d, J=12Hz),
- 3.74 (0.6H, d, J=12Hz), 3.56·3.44 (1H, m), 3.31 (1.2H, s),
- 3.30 (1.8H, s), 3.16 (0.6H, dd, J=17Hz, 6Hz),
- 2.80 (0.4H, dd, J=17Hz, 6Hz), 2.76-2.58 (1H, m),
- 2.39-2.30 (1H, m), 2.08-1.97 (1H, m).
- 2) (2S, 4R) -1  $\sqrt{2}$   $\sqrt{2}$

亜鉛末 57.19g (875mmo1) をテトラヒドロフラン 600m1 に懸濁して 90%に加熱し、プロモ酢酸エチル0.5m1 (4.51mmo1) を加えて 1 時間加熱還流した。更に反応液に1) で得た (2S,4R) -1 -ペンジ

ルオキシカルボニルー2ーシアノメチルー4ーメトキシピロリジン30.00g (109mmol)のテトラヒドロフラン溶液30mlとプロモ酢酸エチル84.9ml (766mmol)を加えて1.5時間加熱還流した。室温に冷却後口過して口液を減圧濃縮し、残渣を酢酸エチルに溶解して飽和炭酸水素ナトリウム水溶液とよく混合した後分液した。有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥した後減圧濃縮し、残渣をジオキサン200mlと1N塩酸水溶液100mlの混合液に溶解して室温で3時間放置した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗後、減圧濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=2:3)に付して標記の化合物28.23gを淡黄色油状物として得た(収率71%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 7.43-7.27 (5H, m), 5.24-5.06 (2H, m), 4.33-4.10 (3H, m),

- 3.93-3.86 (1H, m), 3.78 (0.4H, d, J=12Hz),
- 3.65 (0.6H, d, J=12Hz), 3.52-3.24 (3.6H, m), 3.29 (3H, s),
- 3.14-3.05 (0.4H, m), 2.80-2.62 (1H, m), 2.42-2.32 (1H, m),
- 1.84-1.73 (1H, m), 1.34-1.21 (3H, m).
- 3) (2R, 8 a S) 2 メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン-7-オン
- 2)で得た(2S, 4R) -1-ベンジルオキシカルボニル-2-(3-エトキシカルボニル-2-オキソプロピル)-4-メトキシピロリジン15.00g(41.3mmo1)を酢酸エチル150mlに溶解してピロリジン3.79ml(45.4mmol)、モレキュラーシーブ(MS4A)1.50gおよび20%水酸化パラジウムー炭素3.75gを加え、水素雰囲気下に室温で2時間撹拌した。反応混合物を口過し、口液を減圧濃縮して得られる残渣をテトラヒドロフラン150mlに溶解した。この溶液を、水素化アルミニウムリチウム4.70g(124mmol)のテトラヒドロフラン100ml懸濁液に氷冷撹拌下に滴下し、室温で18時間撹拌した。

反応液を0℃に冷却し、4%水酸化ナトリウム水溶液19m1を注意深く加えた後エタノール250m1を加えて口過した。口液を減圧濃縮して得られた残渣

をアルミナカラムクロマトグラフィー (溶媒;酢酸エチル) に付し、標記の化合物4.13gを微褐色粉末として得た (収率59%)。

 $^{1}H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl_{3})$   $\delta$ ppm:

- 4.12-4.04 (1H, m), 3.54 (1H, dd, J=10Hz, 7Hz),
- 3.34-3.24 (1H, m), 3.29 (3H, s), 2.63-2.30 (5H, m),
- 2.29-2.19 (2H, m), 2.00 (1H, ddd, J=13Hz, 6Hz, 1Hz),
- 1.79-1.67 (1H, m).

### (参考例2)

(2R, 8aS) - 2 - (t - プチルジメチルシリルオキシ) - 1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a - オクタヒドロインドリジン <math>- 7 - オン

1) (2R, 8aS) - 2-ヒドロキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a-オクタヒドロインドリジン-7-オン

参考例1で得た(2R, 8 a S) -2 - メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a - オクタヒドロインドリジン-7 - オン2. 6 3 g (15.5 mm o 1) を 47%臭化水素酸水溶液 26 m 1 に溶解して 100 で 8 時間撹拌し、0 で 6 冷却後炭酸ナトリウムを加えて中和し減圧濃縮した。

残渣にエタノールを加えて不溶物を口去し、口液を減圧濃縮して残渣をアルミナカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール=39:1)に付し、標記の化合物1.30gを淡黄色油状物として得た(収率52%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 4.63-4.56 (1H, m), 3.58 (1H, dd, J=10Hz, 7Hz).
- 3.31-3.24 (1H, m), 2.72-2.44 (4H, m), 2.39-2.32 (1H, m),
- 2.29-2.20 (2H, m), 1.97-1.70 (3H, m).

に水を加えてジクロロメタンで抽出し、有機層を水洗後減圧濃縮して得られる残 渣をアルミナカラムクロマトグラフィー(溶媒; ヘキサン: 酢酸エチル=9:1) に付し、標記の化合物1.98gを無色油状物として得た(収率88%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 4.56-4.48 (1H, m), 3.50-3.42 (1H, m), 3.30-3.23 (1H, m),
- 2.69-2.32 (5H, m), 2.30-2.17 (2H, m), 1.90-1.78 (2H, m),
- 0.88 (9H, s), 0.06 (3H, s), 0.05 (3H, s).

### (参考例3)

(2S, 8aS) -2-クロロ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタ ヒドロインドリジン-7-オン

参考例 2-1)で得た(2R, 8aS) -2-Eドロキシー1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタEドロインドリジンー7-オン1. 55g(10. 0 mmo 1)を四塩化炭素 45m1に溶解し、トリフェニルホスフィン3. 93g(15. 0 mmo 1)を加えて 5 時間加熱還流した。溶媒を減圧留去し、残渣をアルミナカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:1)に付して標記の化合物 1. 52gを淡黄色油状物として得た(収率 88%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 4.47-4.40 (1H, m), 3.39-3.31 (2H, m), 2.78-2.63 (3H, m),
- 2.57-2.42 (2H, m), 2.42-2.26 (3H, m),
- 1.94 (1H, ddd, J=14Hz, 10Hz, 5Hz).

#### (参考例4)

(8 a S) - 2, 2-ジフルオロ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a - オク タヒドロインドリジン-7-オン

 $^{1}$ H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ ppm: 3.55-3.45 (1H, m), 3.33-3.24 (1H, m),

2.72-2.33 (8H, m), 2.17-2.00 (1H, m).

(参考例5)

- (±) -6, 7, 8, 9, 9 a, 10 テトラヒドロピリド [1, 2 a] インドール 8 オン
  - 1) 1-ベンジルオキシカルボニルインドリン-2-メタノール

1ーベンジルオキシカルボニルインドリンー2ーカルボン酸 メチルエステル 33.0g(106mmol)をテトラヒドロフラン450mlに溶解し、水素 化ホウ素リチウム4.6g(212mmol)を3回に分けて加え、室温で5時間攪拌した後、反応液に氷を加えて1時間攪拌して酢酸エチルで抽出した。有機 層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(酢酸エチル:ヘキサン=2:5)に付して、標記の化合物25.0gを無色油状物として得た(収率83%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDC1<sub>3</sub>) δppm:

- 7.47-7.28 (6H, m), 7.19-7.10 (2H, m), 6.97 (1H, t, J=7Hz),
- 5.30 (2H, s), 4.72-4.53 (2H, m), 3.82-3.63 (2H, m),
- 3.33 (1H, dd, J=16Hz, 10Hz), 3.00-2.77 (1H, m).
  - 2) 1-ベンジルオキシカルボニル-2-シアノメチルインドリン
- 1) で得た1-ベンジルオキシカルボニルインドリン-2-メタノールを用いて、参考例1-1) と同様にメタンスルホニル化及びシアノ化を行ない、標記の化合物を橙色油状物として得た(収率65%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>2</sub>)δppm:

- 7.48-7.32 (6H, m), 7.23-7.16 (2H, m), 7.02 (1H, t, J=7Hz).
- 5.31 (2H, s), 4.81-4.68 (1H, m), 3.50 (1H, dd, J=16Hz, 10Hz),
- 3.01 (1H, d, J=16Hz), 2.99·2.50 (2H, m).
- 3) 1 ベンジルオキシカルボニル-2-(3-エトキシカルボニル-2-オキソプロピル) インドリン
- (2S, 4R) 1 ベンジルオキシカルボニル 2 シアノメチル 4 メトキシピロリジンの代わりに 2) で得た <math>1 ベンジルオキシカルボニル 2 シアノメチルインドリンを用いて、参考例 <math>1 2) と同様に反応を行ない、標記の

化合物を黄色油状物として得た(収率47%)。.

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

7.45-4.32 (6H, m), 7.22-7.13 (2H, m), 6.97 (1H, t, J=7Hz),

5.28 (2H, s), 4.92-4.84 (1H, m), 4.22-4.12 (2H, m),

3.46 (1H, dd, J=16Hz, 9Hz), 3.43-3.31 (2H, m),

2.84 (1H, dd, J=6Hz, 4Hz), 2.80 (1H, dd, J=6Hz, 4Hz),

2.74 (1H, dd, J=16Hz, 2Hz), 1.29 (3H, t, J=7Hz).

- 4) 2-(3-エトキシカルボニル-2-オキソプロピル)インドリン
- 3)で得た1-ベンジルオキシカルボニル-2-(3-エトキシカルボニル-2-オキソプロピル)インドリンを用いて、参考例1-3)と同様に、水素ガス/水酸化パラジウム-炭素による加水分解反応(脱ペンジル反応)を行ない、標記の化合物を橙色油状物として得た(収率定量的)。

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

7.08 (1H, d, J=7Hz), 6.99 (1H, t, J=7Hz), 6.68 (1H, t, J=7Hz),

6.57 (1H, d, J=7Hz), 4.28-4.16 (1H, m), 4.12-4.01 (2H, m),

3.39-3.18 (4H, m), 3.03-2.81 (1H, m), 2.81-2.71 (1H, m),

1.32-1.21 (3H, m).

- 5) (±) -6, 7, 8, 9, 9a, 10ーテトラヒドロピリド [1, 2-a] インドール-8-オン
- 4)で得た2-(3-エトキシカルボニル-2-オキソプロピル)インドリン7.0g(28.3mmol)をジクロロメタン140mlに溶解し、4N塩酸/ジオキサン溶液14.1ml(56.6mmol)を加えて室温で2時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣をエタノール140mlに溶解して、ピロリジン2.6ml(31.1mmol)を加え、室温で5時間攪拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣をテトラヒドロフラン100mlに溶解し、氷冷下に水素化アルミニウムリチウム3.18g(84.9mmol)を加えて室温で18時間攪拌した。

反応液を0℃に冷却し、4%水酸化ナトリウム水溶液13mlを注意深く加えた後エタノール150mlを加えて口過した。口液を減圧濃縮して得られた残渣

をアルミナカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:5) に付して、標記の化合物720mgを淡黄色油状物として得た(収率14%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDC1<sub>3</sub>) δppm:

7.20-7.10 (2H, m), 6.61-6.52 (2H, m),

3.20-3.09 (2H, m), 2.74-2.33 (7H, m).

## (参考例 6)

(2R, 8aS) - 2 - フェニル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a - オクタヒドロインドリジン-7 - オン

- 1) (S) -1-ベンジルオキシカルボニル-2-ヒドロキシメチル-4-フェニル-3-ピロリン
- (S) -1 ベンジルオキシカルボニル-4 フェニル-3 ピロリン-2 カルボン酸 メチルエステルを、参考例5 -1 ) と同様に、ホウ素化リチウムで 還元して、標記の化合物を淡黄色粉末として得た(収率78%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDC1<sub>3</sub>) δppm:

7.47-7.27 (10H, m), 6.11-6.07 (0.2H, m), 6.03-5.99 (0.8H, m),

5.23 (2H, dd, J=16Hz, 12Hz), 5.00-4.94 (0.8H, m),

4.85-4.80 (0.2H, m), 4.77-4.70 (0.2H, m),

4.65 (0.8H, dt, J=15Hz, 2Hz), 4.56 (1H, ddd, J=15Hz, 5Hz, 2Hz),

4.26 (1H, br.s), 3.94-3.83 (1H, m), 3.80-3.74 (0.2H, m),

3.72 (0.8H, dd, 12Hz, 7Hz).

- 2) (S) -1-ベンジルオキシカルボニル-2-シアノメチル-4-フェ ニル-3-ピロリン
- 1) で得た (S) -1 ベンジルオキシカルボニル-2 ヒドロキシメチル-4 フェニル-3 ピロリンを用いて、参考例1 1) と同様にメタンスルホニル化及びシアノ化を行ない、標記の化合物を淡黄色粉末として得た(収率80%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDC1<sub>8</sub>) δppm:

7.47-7.29 (10H, m), 6.17-6.11 (1H, m), 5.25 (1H, d, J=12Hz),

5.18 (1H, d, J=12Hz),5.01-4.90 (1H, m), 4.77-4.60 (2H, m),

3.10 (0.7H, dd, J=17Hz, 6Hz), 2.90 (0.7H, dd, J=17Hz, 3Hz),

- 2.86-2.73 (0.6H, m).
- 2) で得た(S) -1-ベンジルオキシカルボニル-2-シアノメチル-4-フェニル-3-ピロリン11.60g(36.4mmol)を酢酸エチル150mlに溶解し、20%水酸化パラジウム-炭素2.32gを加えて水素雰囲気下に室温で7時間攪拌した。反応液を口過して、口液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=4:1)に付して、標記の化合物8.18gを淡褐色油状物として得た(収率70%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 7.44-7.17 (10H, m), 5.26-5.09 (2H, m), 4.32-4.06 (2H, m), 3.50-3.41 (1H, m), 3.37-3.26 (1H, m), 3.21 (0.7H, dd, J=17Hz, 6Hz), 2.93 (0.3Hz, dd, J=17Hz, 6Hz), 2.88-2.59 (2H, m), 2.19-2.07 (1H, m)。

- 4) (2S, 4R) -1  $\sqrt{2}$   $\sqrt{2}$
- (2S, 4R) 1 ベンジルオキシカルボニル 2 シアノメチル 4 メトキシピロリジンの代わりに、3) で得た <math>(2S, 4R) 1 ベンジルオキシカルボニル 2 シアノメチル 4 フェニルピロリジンを用いて、参考例 <math>1 2) と同様に反応を行ない、標記の化合物を淡黄色油状物として得た (収率72%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 7.43-7.17 (10H, m), 5.23-5.07 (2H, m), 4.31-4.10 (4H, m),
- 3.55-3.20 (5H, m), 2.87-2.67 (2H, m), 1.85-1.74 (1H, m),
- 1.32-1.21 (3H, m).
- 5) (2R, 8aS) -2-フェニル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a -オクタヒドロインドリジン-7-オン
- (2S, 4R) 1 ペンジルオキシカルボニル 2 (3 エトキシカルボニル 2 オキソプロピル) 4 メトキシピロリジンの代わりに、4) で得た <math>(2S, 4R) 1 ペンジルオキシカルボニル 2 (3 エトキシカルボニ

ルー2ーオキソプロピル)-4-フェニルピロリジンを用いて、参考例1-3)と同様に反応を行ない、標記の化合物を淡黄色油状物として得た(収率2.7%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

7.42-7.14 (5H, m), 3.42-3.28 (2H, m), 3.18 (1H, dd, J=9Hz, 3Hz),

2.77-2.63 (2H, m), 2.58-2.30 (6H, m), 1.70-1.58 (1H, m).

## (参考例7)

(8aS) - 2, 2-エチレンジオキシ- 1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a -オクタヒドロインドリジン- 7 -オン

- 1) (S)-1-ベンジルオキシカルボニル-4,4-エチレンジオキシ-2-ヒドロキシメチルピロリジン
- (S) -1  $\sqrt{2}$   $\sqrt{2}$

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

7.42-7.29 (5H, m), 5.14 (2H, s), 4.22-4.08 (1H, m),

4.02-3.88 (4H, m), 3.82-3.62 (2H, m), 3.59 (1H, d, J=12Hz),

3.47 (1H, d, J=12Hz), 2.27-2.18 (1H, m), 1.90-1.82 (1H, m).

- 2) (S) -1-ベンジルオキシカルボニル-2-シアノメチル-4, 4-エチレンジオキシピロリジン
- 1) で得た(S) -1 ベンジルオキシカルボニル-4, 4 エチレンジオキシー 2 ヒドロキシメチルピロリジンを用いて、参考例 1 1) と同様にメタンスルホニル化及びシアノ化を行ない、標記の化合物を無色油状物として得た(収率 8 8 8)。

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

7.43-7.28 (5H, m), 5.22-5.08 (2H, m), 4.30-4.21 (1H, m),

4.06-3.88 (4H, m), 3.62-3.44 (2H, m), 3.00-2.72 (2H, m),

2.41-2.29 (1H, m), 2.17-2.10 (1H, m).

3) (8 a S) - 2, 2-エチレンジオキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a - オクタヒドロインドリジン-7-オン

(2S, 4R) -1 - ベンジルオキシカルボニル-2 - シアノメチル-4 - メトキシピロリジンの代わりに、2) で得た(S) -1 - ベンジルオキシカルボニル-2 - シアノメチル-4, 4 - エチレンジオキシピロリジンを出発原料として用いて、参考例1 - 2) 及び1 - 3) と同様の反応を順次行ない、標記の化合物を白色粉末として得た(合計収率1 7 %)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 4.06-3.84 (4H, m), 3.32-3.24 (1H, m), 3.22 (1H, d, J=10Hz), 2.73-2.61 (1H, m), 2.58-2.32 (6H, m), 2.23 (1H, dd, J=13Hz, 6Hz), 1.89 (1H, dd, J=13Hz, 10Hz)。

(参考例8)

(8 a S) - 2 - メチル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a - オクタヒドロインドリジン-7-オン

1) (S)-1-ベンジルオキシカルボニル-4-メチリデンプロリン メ チルエステル

カリウム t-プトキシド1.41g(12.6mmo1) をジエチルエーテル100mlに懸濁し、メチルトリフェニルホスホニウムプロミド4.80g(13.4mmol)を加えて5℃で15分間撹拌した後、(S)-1-ベンジルオキシカルボニルー4ーオキソプロリン メチルエステル2.50g(9.0mmol)のジエチルエーテル溶液30mlを加え35℃で3時間撹拌した。反応液に水冷下に飽和塩化アンモニウム水溶液50mlを加えて分液した後、有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥後減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:ヘキサン=1:3)に付して標記の化合物1.80gを淡黄色油状物として得た(収率72%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 7. 40-7.23 (5H, m), 5. 21-4.95 (4H, m), 4. 60-4.50 (1H, m),
- 4.20-4.09 (2H, m), 3.74 (1.5H, s), 3.60 (1.5H, s),
- 3.07-2.91 (1H, m), 2.65 (1H, d, J=16Hz).
  - 2) (2S)-4-メチルプロリン メチルエステル
  - で得た(S)-1-ベンジルオキシカルポニル-4-メチリデンプロリン

メチルエステル1.80g(6.5mmol)をメタノール50mlに溶解し、10%パラジウムー炭素180mgを加えて水素雰囲気下に室温で2時間撹拌した。反応液を濾過し、遮液を減圧濃縮して標記の化合物0.93gを淡黄色油状物として得た(収率定量的)。

 $^{1}H$  - 核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ ppm:

- 3.82 (1H, t, J=8Hz), 3.74 (3H, s), 3.08 (1H, dd, J=10Hz, 7Hz),
- 2.60 (1H, dd, J=10Hz, 8Hz), 2.33 (1H, dt, J=12Hz, 8Hz),
- 2.28-2.15 (1H, m), 1.44-1.37 (1H, m), 1.27 (1H, dd, J=14Hz, 7Hz),
- 1.02 (3H, d, J=7Hz).
- 3) (2S)-1-ベンジルオキシカルボニル-2-ヒロドキシメチル-4-メチルピロリジン
- 2) で得た(2S) -4-メチルプロリン メチルエステル0.93g(6.5 mmol)をトルエン20mlに溶解し、炭酸水素ナトリウム1.89g(22.5 mmol)の水溶液20mlとクロロギ酸ベンジル1.54ml(10.8 mmol)を加えて室温で一夜撹拌した。反応液に酢酸エチルを加えて抽出し、有機層を水洗後減圧濃縮して(2S) -1-ベンジルオキシカルボニル-4-メチルプロリン メチルエステル1.78gを淡黄色油状物として得た(収率99%)。次いでこの化合物全量を用いて、参考例5-1)と同様に水素化ホウ素リチウムによる還元反応を行ない、標記の化合物1.07gを淡黄色油状物として得た(収率66%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ p p m: 7.42-7.29 (5H, m), 5.14 (2H, br.s), 5.07-4.90 (1H, m), 4.08-3.87 (1H, m), 3.86-3.40 (4H, m), 2.90-2.65 (1H, m), 2.40-2.05 (2H, m), 1.02 (3H, d, J=6Hz)。

- 4) (2S) -1  $\sqrt{2}$   $\sqrt{2$
- 3) で得た(2S) -1  $\sqrt{2}$   $\sqrt{2}$

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ p p m:

- 7.50-7.30 (5H, m), 5.25-5.05 (2H, m), 4.20-3.78 (1.8H, m),
- 3.70-3.62 (0.2H, m), 3.15-2.88 (1.4H, m), 2.84-2.67 (1.2H, m),
- 2.62-2.50 (0.4H, m), 2.45-2.30 (0.8H, m), 2.23-2.00 (1H, m),
- 1.89-1.77 (0.2H, m), 1.60-1.49 (1H, m), 1.10-1.03 (3H, m).
- 5) (2S) -1-ベンジルオキシカルボニル-2-(3-エトキシカルボニル-2-オキソプロピル) -4-メチルピロリジン

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ p p m:

- 7.43-7.28 (5H, m), 5.20-4.99 (2H, m), 4.27-4.03 (3H, m),
- 3.56-3.40 (1.6H, m), 3.37-3.25 (0.4H, m), 3.00-2.89 (0.2H, m),
- 2.89-2.75 (0.8H, m), 2.75-2.56 (1H, m), 2.50-2.22 (1H, m),
- 2.20-2.05 (1H, m), 1.32-1.15 (4H, m), 1.08 (0.6H, d, J=6Hz),
- 1.02 (2.4H, d, J=6Hz).
- 6) (8 a S) 2 メチル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタ ヒドロインドリジン-7-オン

1H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDC1a) δppm:

- 3.34-3.22 (1.2H, m), 2.77 (0.8H, dd, J=9Hz, 3Hz),
- 2.68-2.55 (1H, m), 2.51-2.43 (2H, m), 2.39-2.24 (5H, m),
- 2.20-2.10 (1H, m), 1.87-1.75 (0.8H, m), 1.57-1.51 (0.2H, m),
- 1.14 (2.4H, d, J=7Hz), 1.04 (0.6H, d, J=7Hz).

(参考例9)

(8 a S) -8-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a - オクタヒドロインドリジン-7-オン

- 1) (2S) -1-メチルマロニル-2-(1-カルボキシエチル) ピロリジン

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル (500MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

- 4.55-4.47 (0.4H, m), 4.34-4.25 (0.6H, m), 3.76 (2.4H, s),
- 3.59-3.42 (4H, m), 3.25-3.16 (0.6H, m), 2.14-1.80 (5H, m),
- 1.18 (1.8H, d, J=7Hz), 1.08 (1.2H, d, J=7Hz).
- 2) (8 a S) 6 メトキシカルボニル-8 メチル-1, 2, 3, 5,6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン-5, 7 ジオン
- 1)で得た(2S)-1-メチルマロニル-2-(1-カルボキシエチル)ピロリジン4.47g(17.0mmol)をテトラヒドロフラン120mlに溶解し、カルボニルジイミダゾール4.13g(25.5mmol)を加えて室温で30分間撹拌した後、1,8-ジアザピシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン3.81ml(25.5mmol)を加えて更に1時間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣にジクロロメタンと1N塩酸水溶液を加え分液した。有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、標記の化合物4.16gを褐色油状物として得た(収率定量的)。

 $^{1}H$ -核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl $_{3}$ ) $\delta$ ppm:

- 3.90 (3H, s), 3.89-3.82 (1H, m), 3.73-3.64 (1H, m), 3.53-3.32 (2H, m), 2.67-2.52 (2H, m), 2.33-2.25 (0.5H, m),
- 2.07-1.96 (1.5H, m), 1.87-1.74 (1H, m), 1.68-1.55 (1H, m),
- 1.43 (1.5H, d, J=7Hz), 1.12 (1.5H, d, J=7Hz).
- 3) (8aS) -8-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタ ヒドロインドリジン-5, 7-ジオン
- 2) で得た(8 a S) -6-メトキシカルボニル-8-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン-5, 7-ジオン4. 1 6 g (17.0mmol)を10%酢酸水溶液40mlに溶解し、110℃で30分間撹拌した後、室温にまで冷却した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えてアルカリ性にした後、ジクロロメタン:イソプロパノール=4:1の混合液で抽出した。有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、標記の化合物2.62gを褐色油状物として得た(収率92%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル (500MHz, CDC1<sub>3</sub>) δppm:

- 4.03-3.97 (0.3H, m), 3.74-3.41 (2.7H, m), 3.27 (1.4H, s),
- 3.26 (0.6H, s), 2.73-2.67 (0.3H, m), 2.38-2.32 (0.7H, m),
- 2.30·2.23 (0.7H, m), 2.14·2.01 (1.3H, m), 1.96·1.86 (1H, m),
- 1.73-1.63 (1H, m), 1.77 (2.1H, d, J=7Hz), 1.08 (0.9H, d, J=7Hz).
- 4) (8 a S) -8-メチル-7-(1-ピロリジニル) -1, 2, 3, 5, 8, 8 a ヘキサヒドロインドリジン-5-オン
- 3) で得た(8 a S) -8  $\times$  +  $\times$

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 4.52 (1H, s), 3.80-3.65 (2H, m), 3.44-3.34 (1H, m),
- 3.33-3.17 (4H, m), 2.61-2.43 (1H, m), 2.02-1.89 (6H, m),
- 1.88·1.72 (4H, m), 1.01 (3H, d, J=7Hz).

- 5) (8 a S) -8-メチル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタ ヒドロインドリジン-7-オン

1H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 3.36-3.29 (1H, m), 3.18-3.13 (1H, m), 2.72-2.63 (1H, m), 2.40-2.30 (3H, m), 2.26-2.17 (1H, m), 2.05-1.91 (3H, m), 1.87-1.78 (1H, m), 1.64-1.55 (2H, m), 1.01 (3H, d, J=7Hz)。

## (参考例10)

- (2S, 8aS) -2-メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7-オン
  - 1) (2S, 4S) -4-メトキシ-1-メチルマロニルホモプロリン
- (2S, 4S) -4-メトキシーホモプロリン 塩酸塩4.40g(22.5 mmol)をジクロロメタン100mlに懸濁し、トリエチルアミン7.52ml(54mmol)を加えて、氷冷撹拌下メチルマロニルクロリド2.66ml(24.8mmol)を滴下し、同温度で15分間攪拌した。更に室温で2時間撹拌した後、反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて分液し、水層に濃塩酸を加えてりHを2としてジクロロメタン:イソプロパノール=4:1の混合液で抽出した。有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、標記の化合物5.83gを褐色油状物として得た(収率:定量的)。

1H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 4.51-4.44 (0.8H, m), 4.36-4.30 (0.2H, m), 4.05-3.97 (1H, m), 3.78-3.73 (2.6H, m), 3.67-3.52 (2.4H, m), 3.48-3.38 (2H, m), 3.35-3.30 (3H, m), 3.14-3.08 (0.8H, m), 3.03 (0.2H, dd, J=16Hz, 9Hz), 2.83-2.77 (0.2H, m), 2.69 (0.8H, dd, J=16Hz, 9Hz), 2.21-2.12 (3H, m).

- 2) (2S, 8aS) -2-メトキシー6-メトキシカルボニル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-5, 7-ジオン
- 1) で得た (2 S, 4 S) 4 メトキシー1 メチルマロニルホモプロリン 5.83g (2 2.5 mmol)をテトラヒドロフラン90mlに懸濁し、カルボニルジイミダゾール4.02g (2 4.8 mmol)を加えて室温で30分間撹拌した後、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]-7-ウンデセン3.71ml(24.8 mmol)を加えて更に1時間撹拌した。反応液を減圧濃縮し、残渣にジクロロメタンと1 N塩酸水溶液を加えて分液した。有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、標記の化合物 5.21gを褐色油状物として得た(収率:定量的)。

 $^{1}$ H -核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDC18) $\delta$ ppm: 4.02-3.96 (1H, m), 3.90 (3H, s), 3.87-3.79 (1H, m), 3.78-3.72 (1H, m), 3.55 (1H, dd, J=13Hz, 6Hz), 3.39-3.29 (4H, m), 2.74 (1H, dd, J=17Hz, 13Hz), 2.59 (1H, dd, J=13Hz, 4Hz), 2.49-2.42 (1H, m), 1.84-1.77 (1H, m)。

- 3) (2S, 8aS) 2-メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a -オクタヒドロインドリジン-5, 7-ジオン
- 2) で得た (2 S, 8 a S) -2-メトキシ-6-メトキシカルボニル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン-5, 7 ジオン5. 2 1 g (2 2.5 mm o 1) を10%酢酸水溶液50 m l に溶解し、110℃で1時間撹拌した後,室温にまで冷却した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えてアルカリ性にした後、ジクロロメタン:イソプロパノール=4:1の混合液で抽出した。有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥後減圧濃縮して、標記の化合物3.38gを淡褐色油状物として得た(収率82%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>8</sub>)δppm: 4.06-3.90 (3H, m), 3.52 (1H, dd, J=12Hz, 5Hz), 3.37-3.28 (5H, m), 2.73 (1H, dd, J=17Hz, 3Hz), 2.55-2.43 (2H, m), 1.95-1.87 (1H, m)。

- 4) (2S,8aS)-2-メトキシ-7-(1-ピロリジニル)-1,2,3,5,8,8a-ヘキサヒドロインドリジン-5-オン
- 3) で得た(2S, 8aS) -2-メトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a-オクタヒドロインドリジン-5, 7-ジオン3. 38g(18.4mmo
- 1) をエタノール34mlに溶解し、ピロリジン3.07ml(36.8mmo
- 1) を加えて室温で30分間放置した後、溶媒および過剰のピロリジンを減圧留去し、標記の化合物4.26gを褐色油状物として得た(収率98%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>8</sub>)δppm:

- 4.60 (1H, s), 4.05-3.96 (1H, m), 3.77-3.65 (2H, m),
- 3.57 (1H, dd, J=12Hz, 5Hz), 3.34 (3H, s), 3.33-3.16 (4H, m),
- 2.87 (1H, dd, J=16Hz, 5Hz), 2.50-2.37 (2H, m), 2.02-1.83 (4H, m),
- 1.80-1.70 (1H, m).
- 5) (2S,8aS)-2-メトキシ-1,2,3,5,6,7,8,8a<sup>-1</sup> -オクタヒドロインドリジン-7-オン
- 4)で得た(2S,8aS) -2-メトキシ-7-(1-ピロリジニル)-1, 2,3,5,8,8a-ヘキサヒドロインドリジン-5-オン4.26g(18.1mmo1)をテトラヒドロフラン50m1に溶解し、氷冷撹拌下に水素化リチウムアルミニウム2.10g(55mmo1)を加えた。室温で3時間撹拌し、反応液に1N水酸化ナトリウム水溶液8.40m1を注意深く加えた後、エタノールを加え、不溶物を口去した。口液を減圧濃縮し、残渣をアルミナカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル)に付して標記の化合物1.60gを微褐色油状物として得た(収率51%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 3.96-3.90 (1H, m), 3.35-3.21 (2H, m), 3.32 (3H, s),
- 2.75-2.65 (1H, m), 2.55-2.17 (5H, m), 1.63-1.53 (2H, m),
- 1.32-1.20 (1H, m).

#### (参考例11)

(8 a S) - 2 - メチリデン-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a - オクタヒ・ドロインドリジン-7 - オン

1) (S) -1-ベンジルオキシカルボニル-2-シアノメチル-4-メチリデンピロリジン

参考例 8-1)で得た (S)-1-ペンジルオキシカルボニルー4-メチリデンプロリン メチルエステルを用いて、参考例 <math>5-1)及び 5-2)と同様に還元反応、メタンスルホニル化及びシアノ化を行ない、標記の化合物を無色油状物として得た(収率 61%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 7.42-7.30 (5H, m), 5.20-5.02 (4H, m), 4.36-4.27 (1H, m), 4.22-3.93 (2H, m), 2.92 (1H, dd, J=16Hz, 9Hz), 2.80-2.38 (3H, m)。

- 2) (S) -1-(t-プトキシカルボニル)-4-メチリデンホモプロリン エチルエステル
- 1)で得た(S) -1-ベンジルオキシカルボニルー2ーシアノメチルー4ーメチリデンピロリジン7.00g(27.3mmol)をエタノール100mlに溶解し、塩化水素ガスを通じながら室温で1時間攪拌し、更に80℃で2時間攪拌した。エタノールを留去して残渣を水100mlに溶解し、水層を酢酸エチルで洗浄した後、水層にジオキサン50mlを加えた。この溶液にトリエチルアミンを加えて中和し、更にトリエチルアミン3.80ml(27.3mmol)を加えた後、ジーtーブチル・ジカーボネート8.95g(41.0mmol)を加えて室温で2時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥した後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:ヘキサン1:3)に付して標記の化合物3.40gを無色油状物として得た(収率46%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 5.01 (2H, br.s), 4.43-4.21 (1H, m), 4.12 (2H, dd, J=14Hz, 7Hz), 4.08-3.90 (1H, m), 3.84 (1H, dd, J=15Hz, 2Hz), 2.88-2.55 (2H, m), 2.41-2.29 (2H, m), 1.49 (9H, s), 1.30-1.18 (3H, m)。

- 3) (S) 4 メチリデンホモプロリン トリフルオロ酢酸塩
- 2) で得た(S) -1-(t-プトキシカルボニル)-4-メチリデンホモプロリン エチルエステル3.40g(12.6mmol)をエタノール35ml

に溶解し、1N水酸化ナトリウム水溶液18.9ml(18.9mmol)を加えて室温で2時間攪拌した後、反応液を減圧濃縮し、残渣に酢酸エチルと水を加えて分液した。有機層を水洗し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をジクロロメタン30mlに溶解し、トリフルオロ酢酸9.7ml(126mmol)を加えて室温で2時間攪拌した後、減圧濃縮して、標記の化合物3.08gを白色粉末として得た(収率96%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 5.22-5.12 (2H, m), 4.03-3.88 (2H, m), 3.80-3.30 (3H, m), 2.91-2.79 (2H, m)。

- 4) (8 a S) 2 メチリデン- 1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン- 7 オン
- (2S,4S)-4-メトキシホモプロリン 塩酸塩の代わりに3)で得た(S)-4-メチリデンホモプロリン トリフルオロ酢酸塩を用いて、参考例10-1)、10-2)、10-3)、10-4)及び10-5)と同様の反応を順次行ない、標記の化合物を黄色油状物として得た(収率39%)。

 $^{1}$ H -核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl $_{3}$ )  $\delta$ ppm:4.97 (1H, br.s), 4.94 (1H, br.s), 3.72 (1H, d, J=13Hz), 3.34-3.25 (1H, m), 3.00-2.91 (1H, m), 2.70-2.20 (8H, m)。

## (参考例12)

- (2S, 8aS) 2 メチルチオー1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7-オン
- 1) (2S, 4R) -1  $\sqrt{2}$   $\sqrt{2}$
- a) (2S, 4R) -1-ベンジルオキシカルボニル-4-ヒドロキシプロリン メチルエステル 77. 70g (245mmol) をジクロロメタン600m 1に溶解し、トリエチルアミン37.5ml (270mmol)、pートルエンスルホニルクロリド49.04g (257mmol) 及び4-ジメチルアミノピリジン2.99g (24.5mmol) の順に加え、室温で一夜攪拌した。反応混合物を減圧濃縮して残渣に酢酸エチルと水を加え、有機層を水洗後、無水硫酸マ

- b) a)で得た (2S, 4R) 1 ベンジルオキシカルボニル-4-(p-hルエンスルホニルオキシ) プロリン メチルエステル <math>106.18g(245mmo1) を、参考例 5-1)と同様にして還元し、標記の化合物 104.98g を黄色油状物として得た (収率:定量的)。
- 2) (2S, 4S) -1-ベンジルオキシカルボニル-2-(t-プチルジ メチルシリルオキシ)メチル-4-アセチルチオピロリジン
- a) 1)で得た(2S, 4R) -1ーベンジルオキシカルボニル-2ーヒドロキシメチル-4-(pートルエンスルホニルオキシ)ピロリジン104.98g(245mmol)をジクロロメタン610mlに溶解し、トリエチルアミン37.4ml(269mmol)、tープチルジメチルシリルクロリド38.76g(257mmol)及び4ージメチルアミノピリジン2.99g(24.5mmol)の順に加え、室温で一夜攪拌した。反応混合物を減圧濃縮して残渣に酢酸エチルと水を加え、有機層を水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=1:1)に付して(2S, 4R)-1-ベンジルオキシカルボニル-2-(tープチルジメチルシリルオキシ)メチル-4-(pートルエンスルホニルオキシ)ピロリジン119.34gを黄色油状物として得た(収率94%)。

- 3) (2S, 4S) 1 ベンジルオキシカルボニル 2 (t ブチルジメチルシリルオキシ) メチル 4 メチルチオピロリジン
- 2)で得た(2 S, 4 S) -1 ベンジルオキシカルボニル-2 (t ブチルジメチルシリルオキシ) メチル-4 アセチルチオピロリジン 3 5 . 2 6 g (8 3 . 2 m m o 1 ) をメタノール 1 6 6 m 1 に溶解し、ヨウ化メチル 6 . 2 2 m 1 (9 9 . 9 m m o 1 ) を加えた後、0  $\mathbb C$   $\mathbb C$  2 8 %ナトリウムメトキシド/メタノール溶液 1 4 9 m 1 (4 1 6 m m o 1 ) を加え、同温度で 1 時間攪拌した。反応混合物を減圧濃縮して残渣に酢酸エチルと水を加え、有機層を水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;ヘキサン:酢酸エチル= 9 : 1 )に付して、標記の化合物 3 0 . 7 4 g を黄色油状物として得た(収率 9 3 %)
- 4) (2S, 4S) -1-ベンジルオキシカルボニル-2-ヒドロキシメチル-4-メチルチオピロリジン
- 3) で得た(2S, 4S) -1-ベンジルオキシカルボニル-2-(t-ブチルジメチルシリルオキシ)メチル-4-メチルチオピロリジン30.74g(77.7mmo1)をテトラヒドロフラン155m1に溶解し、1Mテトラブチルアンモニウムフルオリド/テトラヒドロフラン溶液85.5m1(85.5mmo1)を加えて室温で一夜攪拌した。反応混合物を減圧濃縮して残渣に酢酸エチルと水を加え、有機層を水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=1:1)に付して、標記の化合物21.87gを淡黄色油状物として得た(収率:定量的)。
- 5) (2S, 4S) -1-ベンジルオキシカルボニル-2-シアノメチル-4-メチルチオピロリジン
- 4) で得た(2S, 4S) -1 ベンジルオキシカルボニル-2 ヒドロキシメチル-4 メチルチオピロリジンを用いて参考例1 -1) と同様にメタンスルホニル化及びシアノ化を行ない、標記の化合物を黄色油状物として得た(収率5 2%)。
  - 6) (25,45)-4-メチルチオホモプロリン 塩酸塩

- $_{-5}$ ) で得た( $_{2}$  S,  $_{4}$  S)  $_{-1}$  ベンジルオキシカルボニル $_{-2}$  シアノメチル $_{-4}$  メチルチオピロリジン 7.  $_{43g}$  ( $_{25}$  .  $_{6mmo1}$ ) に  $_{35\%$  塩酸 3 7  $_{m1}$  を加え、  $_{80}$  でで一夜攪拌した。 反応混合物を減圧濃縮し、残渣を酢酸エチルで洗浄後、エタノールを加え不溶物を口去し、口液を減圧濃縮して、標記の化合物 5. 3 9  $_{g}$  を褐色油状物として得た(収率:定量的)。
- 7) (2S, 8aS) 2 メチルチオー1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a-オクタヒドロインドリジン-7-オン

 $(2S, 4S) - 4 - \lambda$ トキシホモプロリン 塩酸塩の代わりに 6)で得た  $(2S, 4S) - 4 - \lambda$ チルチオホモプロリン 塩酸塩を用いて、参考例 10 - 1)、 10 - 2)、 10 - 3)、 10 - 4)及び 10 - 5)と同様の反応を順次行ない、 標記の化合物を黄色油状物として得た (収率 37%)。

 $^{1}$ H  $^{-}$ 核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl $_{3}$ )  $^{5}$  ppm: 3.32-3.23 (2H, m), 3.17 (1H, dd, J=10Hz, 2Hz), 2.72-2.59 (2H, m), 2.51-2.40 (2H, m), 2.37-2.31 (4H, m), 2.15 (3H, s), 1.52-1.45 (1H, m)。

## (参考例13)

(2S, 8aS) - 2 - エチルチオー1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a - オクタヒドロインドリジン- <math>7 - オン

ョウ化メチルの代わりにヨウ化エチルを用いて、参考例12-3)、12-4)、12-5)、12-6) 及び12-7) と同様の反応を順次行ない、標記の化合物を黄色油状物として得た(収率8%)。

 $^{1}$ H -核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl $_{3}$ )  $\delta$ ppm: 3.36-3.28 (2H, m), 3.16 (1H, dd, J=10Hz, 2Hz), 2.74-2.57 (4H, m), 2.52-2.41 (2H, m), 2.38-2.27 (4H, m), 1.53-1.46 (1H, m), 1.28 (3H, t, J=7Hz)。

#### (参考例14)

(2S, 8aS) - 2 - プチルチオー1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7-オン

ヨウ化メチルの代わりに臭化プチルを用いて、参考例12-3)、12-4)、12-5)、12-6) 及び12-7) と同様の反応を順次行ない、標記の化合物

を褐色油状物として得た(収率13%)。

(参考例15)

(2S, 8aS) - 2 - メチルスルホニル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a-オクタヒドロインドリジン-7-オン

参考例12で得た(2S,8aS)-2-メチルチオ-1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン-7-オン1.14g(6.15mm o1)をメタノール15mlに溶解し、2N硫酸4.6ml(9.23mmo1)とタングステン酸ナトリウム二水和物101mg(0.31mmo1)の水溶液3mlを加え、55℃で30%過酸化水素水1.35ml(12.3mmo1)を滴下した。同温度で1時間攪拌し、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液30mlを加え、ジクロロメタンで抽出した。有機層を水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮し、残渣をアルミナカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル)に付して、標記の化合物945mgを黄色油状物として得た(収率71%)。

 $^{1}$ H -核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl  $_{3}$ )  $\delta$ ppm: 3.62-3.55 (2H, m), 3.63-3.32 (1H, m), 2.93 (3H, s), 2.69-2.56 (3H, m), 2.52-2.43 (2H, m), 2.41-2.33 (3H, m), 2.02-1.94(1H, m)。

(参考例16)

6-スピロシクロプロパン- [(8 a S) -1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a -オクタヒドロインドリジン] - 7 - オン

- 1) 1-xトキシカルボニル-1-[(S)-2-xトキシカルボニルメチルピロリジン-1-4ル] メチルシクロプロパン
- (S) -1-ベンジルオキシカルボニルホモプロリン エチルエステル12.74g(43.7mmol)をエタノール200mlに溶解し、10%パラジウム/炭素4.25gを加えて水素雰囲気下で室温で2時間攪拌した。反応混合物を口過し、口液減圧濃縮して残渣をエタノール150mlに溶解し、氷冷攪拌下で1-エトキシカルボニルー1-ホルミルシクロプロパン6.84g(48.1 mmol)を加えて0℃で1時間攪拌後、シアノトリヒドロホウ酸ナトリウム1.92g(30.6mmol)を加えた。室温で2日間攪拌し、水300mlを加えて酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗後無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧

濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒; ヘキサン: 酢酸 エチル=7:3)に付して、標記の化合物3.07gを淡褐色油状物として得た (収率25%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ p p m:

- 4.21-4.07 (4H, m), 3.24 (1H, d, J=13Hz), 3.22-3.12 (1H, m),
- 2.82-2.68 (2H, m), 2.28-2.13 (3H, m), 2.03-1.90 (1H, m),
- 1.82-1.64 (2H, m), 1.56-1.45 (1H, m), 1.36-1.21 (7H, m),
- 1.12-1.03 (1H, m), 0.84-0.70 (2H, m).
- 2) 6-スピロシクロプロパン-[(8aS)-8-エトキシカルボニル-1,
- 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン] 7 オン

55%水素化ナトリウム518mg(11.9mmol)をトルエン20m1に懸濁し、パスツールピペットを用いてメタノール3滴を加えて130℃に加熱した。反応液に1)で得た1-エトキシカルボニル-1-[(S)-2-エトキシカルボニルメチルピロリジン-1-イル]メチルシクロプロパン3.06g(10.8mmol)を加えて10分間加熱環流した。0℃に冷却後、飽和食塩水を加えて酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル:メタノール=9:1)に付して標記の化合物2.02gを無色油状物として得た(収率79%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

- 4.31-4.15 (2H, m), 3.32 (1H, d, J=11Hz), 3.15 (1H, td, J=9Hz, 3Hz),
- 2.92-2.82 (2H, m), 2.67 (1H, d, J=11Hz), 2.29 (1H, q, J=9Hz),
- 2.12-1.80 (3H, m), 1.71-1.55 (2H, m), 1.29 (3H, t, J=7Hz).
- 1.09-1.02 (1H, m), 0.99-0.92 (1H, m), 0.69-0.62 (1H, m).
- 3) 6-22 $\frac{1}{2}$ 0 $\frac{1}{2}$ 0 $\frac{1}{2}$ 1 $\frac{1}{2}$ 3, 5, 6, 7',
- 8,8 a オクタヒドロインドリジン] 7 オン
- 2) で得た6-スピロシクロプロパン- [(8aS) -8-エトキシカルボニル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン] -7-オン
- 50mg (0.21mmol) をエタノール1mlに溶解し、1N水酸化ナトリ

ウム水溶液  $1 \, \text{ml}$  を加えて  $1 \, \text{時間加熱環流した。反応混合物を減圧濃縮し、残渣をアルミナカラムクロマトグラフィー (溶媒;酢酸エチル) に付して、標記の化合物 <math>1 \, 0 \, \text{mg}$  を無色油状物として得た (収率  $2 \, 9 \, \%$ )。

<sup>1</sup>H - 核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ p p m: 3.17 (1H, td, J=9Hz, 3Hz), 2.76 (1H, d, J=12Hz), 2.69 (1H, d, J=12Hz), 2.67 (1H, dd, J=16Hz, 3Hz), 2.56-2.44 (1H, m), 2.34 (1H, dd, J=16Hz, 12Hz), 2.30-2.18 (1H, m), 2.12-1.93 (2H, m), 1.90-1.78 (1H, m), 1.64-1.50 (2H, m), 1.08-1.00 (1H, m), 0.96-0.88 (1H, m), 0.67-0.58 (1H, m)。

## (参考例17)

(8aS) - 2, 2-ジメチル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7-オン

1) (S) -1-ベンジルオキシカルボニル-4, 4-ジメチル-2-ヒドロキシメチルピロリジン

水素化アルミニウムリチウム25.72g(678mmo1)をテトラヒドロフラン500m1に懸濁し、氷冷攪拌下、(S)-4,4ージメチルー2ーヒドロキシメチルー5ーオキソピロリジン32.35g(226mmo1)のテトラヒドロフラン溶液300m1を8乃至17℃で20分間かけて滴下した。7時間過熱環流した後、0℃に冷却し、4%水酸化ナトリウム水溶液103m1を注意深く加え、不溶物を口去した。口液を減圧濃縮して残渣をジクロロメタン500m1に溶解し、トリエチルアミン40.94mmo1)を加えた後、氷冷攪拌下、ベンジルオキシカルボニルクロリド38.71m1(271mmo1)を加えて同温度で1時間攪拌し、更に室温で1時間攪拌した。反応混合物に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えてジクロロメタンで抽出し、有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=1:1)に付して、標記の化合物43.97gを無色油状物として得た(収率74%)。

 $^1$ H -核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl $_3$ )  $\delta$ ppm: 7.42-7.29 (5H, m), 5.20-5.10 (2H, m), 4.89 (1H, dd, J=9Hz, 3Hz),

- 4.14-4.05 (1H, m), 3.73-3.59 (2H, m), 3.41 (1H, d, J=11Hz), 3.06 (1H, d, J=11Hz), 1.80 (1H, ddd, J=13Hz, 7Hz, 1Hz), 1.33 (1H, dd, J=12Hz, 10Hz), 1.08 (3H, s), 1.02 (3H, s).
- 2) (8 a S) 2, 2 ジメチル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン-7-オン

(2S, 4S) - 1 - ベンジルオキシカルボニル - 2 - ヒドロキシメチル - 4 - メチルチオピロリジンの代わりに、1) で得た (S) - 1 - ベンジルオキシカルボニル - 4 , 4 - ジメチル - 2 - ヒドロキシメチルピロリジンを用いて、参考例 <math>12 - 5 )、12 - 6 ) 及び 12 - 7 ) と同様の反応を順次行ない、標記の化合物を褐色油状物として得た(収率 36%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 3.26-3.19 (1H, m), 2.89 (1H, d, J=9Hz), 2.68-2.57 (1H, m),
- 2.49-2.25 (5H, m), 2.07 (1H, d, J=9Hz), 1.73 (1H, dd, J=12Hz, 6Hz),
- 1.40 (1H, dd, 12Hz, 10Hz), 1.20 (3H, s), 1.07 (3H, s).

## (参考例18)

- 1) 1-シアノ-1-ホルミルメチルシクロペンタン ジエチルアセタール ジイソプロピルアミン22.00ml (157mmol)をテトラヒドロフラン500mlに溶解し、氷冷下に1.57M n-ブチルリチウム/ヘキサン溶液100ml (157mmol)を滴下し、同温度で30分間攪拌した。反応容器をドライアイス-アセトン浴に移し、シクロペンタンカルボニトリル14.89ml (143mmol)を滴下して、-78℃で15分間攪拌した後、ヘキサメチルホスホン酸アミド27.31ml (157mmol)のテトラヒドロフラン溶液50mlを滴下し、同温度で30分攪拌後、プロモアセトアルデヒド ジエチルアセタール23.62ml (157mmol)を滴下し、-78℃で2時間攪拌し、更に室温で20時間攪拌した。反応液に氷水を加えて酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗後、無水硫酸マグネシウムで乾燥して減圧濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=19:1)

)

に付して、標記の化合物 2 3. 9 2 gを無色油状物として得た(収率 7 9 %)。 <sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ p p m: 4.75 (1H, t, J=5Hz), 3.76·3.66 (2H, m), 3.61·3.52 (2H, m), 2.22·2.13 (2H, m), 1.93 (2H, d, J=5Hz), 1.91·1.63 (6H, m), 1.23 (6H, t, J=7Hz)。

2) 1-アミノメチル-1-ホルミルメチルシクロペンタン ジエチルアセ タール

水素化アルミニウムリチウム12.33g(325mmo1)をテトラヒドロフラン460mlに懸濁し、氷冷攪拌下、濃硫酸8.66ml(162mmol)を10分間かけて滴下した。0℃で1時間攪拌し、1)で得た1-シアノ-1-ホルミルメチルシクロペンタン ジエチルアセタール22.88g(108mmol)を少量ずつ加え、室温で2時間攪拌した。反応液を再び0℃に冷却し、4%水酸化ナトリウム水溶液49.3mlを注意深く加えて不溶物を口去し、口液を減圧濃縮して、標記の化合物18.69gを淡黄色油状物として得た(収率80%)

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 4.51 (1H, t, J=5Hz), 3.70-3.60 (2H, m), 3.54-3.41 (2H, m), 2.50 (2H, s), 1.70 (2H, d, J=5Hz), 1.69-1.34 (10H, m), 1.21 (6H, t, J=7Hz)。

- 2)で得た  $1-\gamma \le J$ メチルー1-xルミルメチルシクロペンタン ジエチルアセタール 1 8. 6 8 (8 6. 7 mm o 1) をジエチルエーテル 4 0 0 m 1 に溶解し、氷冷攪拌下、メチルビニルケトン 8. 6 7 m 1 (1 0 4 mm o 1) を加えて室温で 2 4 時間攪拌した後、3 N 塩酸 2 0 0 m 1 で抽出した。水層を 1 0 0  $\mathbb C$  で 3 時間攪拌した後、室温にまで冷却し、炭酸水素ナトリウムでアルカリ性にしてから酢酸エチルで抽出した。有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥後減圧濃縮し、残渣をアルミナカラムクロマトグラフィー(溶媒;ヘキサン:酢酸エチル= 9 : 1) に付して、標記の化合物 5 . 7 5 g を無色油状物として得た(収率 3 4 %)。

WO 03/015781 PCT/JP02/08276 441

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 3.27-3.21 (1H, m), 3.03 (1H, d, J=9Hz), 2.69-2.59 (1H, m),
- 2.47 (1H, dt, J=13Hz, 2Hz), 2.42-2.26 (4H, m), 2.19 (1H, d, J=9Hz),
- 1.86 (1H, dd, J=12Hz, 5Hz), 1.80-1.46 (9H, m).

(参考例19)

(8aS) - 2 - メチル - 3, 5, 6, 7, 8, 8 a - ヘキサヒドロインドリジンー7ーオン

1) (S)-2-カルボキシメチル-4-メチル-3-ピロリン 塩酸塩 参考例11-1)で得た(S)-1-ベンジルオキシカルボニル-2-シアノ メチル-4-メチリデンピロリジン24.00g(93.6mmo1)に濃塩酸 150mlを加え、80℃で一夜攪拌した後減圧濃縮した。残渣に酢酸エチルを 加えて分液し、水層を減圧濃縮して、標記の化合物16.60gを白色粉末とし て得た(収率:定量的)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)δppm: 5.47-5.40 (1H, m), 4.60-4.47 (1H, m), 4.15-3.75 (2H, m), 3.60-3.35 (2H, m), 1.74 (3H, m).

- (8 a S) -2-メチル-3, 5, 6, 7, 8, 8 a ヘキサヒドロイ ンドリジンー7ーオン
- (2S, 4S) 4 メトキシホモプロリン 塩酸塩の代わりに1)で得た(S)-2-カルボキシメチル-4-メチル-3-ピロリン 塩酸塩を用いて、参考例 10-1)、10-2)、10-3)、10-4) 及び10-5) と同様の反応を順 次行ない、標記の化合物を橙色油状物として得た(収率10%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm:

- 5.44-5.38 (1H, m), 3.75-3.67 (1H, m), 3.58 (1H, dd, J=13Hz, 3Hz),
- 3.48-3.39 (1H, m), 3.30-3.21 (1H, m), 3.01-2.92 (1H, m),
- 2.63-2.49 (2H, m), 2.45-2.35 (2H, m), 1.79 (3H, s).

(参考例20)

(2R, 8aS) - 2-エトキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7-オン

(2 S, 4 R) -1 - ベンジルオキシカルボニル-4 - メトキシプロリンの代わりに (2 S, 4 R) -1 - ベンジルオキシカルボニル-4 - エトキシプロリンを用いて、参考例1-1)、1-2) 及び1-3) と同様の反応を順次行ない、標記の化合物を橙色油状物として得た(収率5%)。

 $^{1}$ H - 核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$ ppm: 4.21-4.13 (1H, m), 3.60-3.38 (3H, m), 3.28 (1H, dd, J=11Hz, 7Hz), 2.66-2.20 (7H, m), 1.99 (1H, dd, J=13Hz, 6Hz), 1.82-1.70 (1H, m), 1.20 (3H, t, J=7Hz)。

## (参考例21)

- (8 a S) 2,  $2 \mathcal{I}$ ロピレンジオキシー 1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8  $a \mathcal{I}$  a オクタヒドロインドリジン  $7 \mathcal{I}$  オン
- (S) -1  $\sqrt{3}$   $\sqrt{3}$   $\sqrt{3}$   $\sqrt{4}$   $\sqrt{$

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 4.00-3.82 (4H, m), 3.51 (1H, d, J=10Hz), 3.33-3.25 (1H, m),
- 2.74-2.62 (1H, m), 2.57-2.48 (2H, m), 2.43-2.31 (5H, m),
- 1.86-1.62 (2H, m), 1.82 (1H, dd, J=13Hz, 10Hz).

## (参考例22).

- (8 a S) 2, 2 (2', 2' ジメチルプロピレンジオキシ) <math>-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン- <math>7 オン
- - <sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

3.57-3.41 (5H, m), 3.31-3.24 (1H, m), 2.73-2.62 (1H, m), 2.57-2.46 (2H, m), 2.42-2.31 (5H, m), 1.82 (1H, dd, J=13Hz, 10Hz), 1.00 (3H, s), 0.96 (3H, s).

## (参考例23)

(2S, 8aS) - 2 - フェノキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オ クタヒドロインドリジン-7 - オン

1) (2S, 4S) -1-ベンジルオキシカルボニル-4-フェノキシホモ プロリン ベンジルエステル

(2 S, 4 R) -1 - ベンジルオキシカルボニルー4 - ヒドロキシホモプロリン ベンジルエステル18.29 g (49.5 mmol)をテトラヒドロフラン300 mlに溶解し、フェノール6.53 ml (74.3 mmol)とトリフェニルホスフィン19.48 g (74.3 mmol)を加えて、0℃に冷却した。同温度で、攪拌下、ジエチルアゾジカルボキシレート (DEAD) 11.69 ml (74.3 mmol)を滴下し、室温で一夜攪拌した。反応混合物を減圧濃縮し、残渣にジエチルエーテルを加えて不溶物を口去した。口液を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び水で順次洗浄して無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=3:1 に付して標記の化合物11.14 gを無色油状物として得た(収率51%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

7.40-7.21 (12H, m), 6.97 (1H, t, J=7Hz), 6.84 (2H, d, J=8Hz),

5.21-4.99 (4H, m), 4.93-4.83 (1H, m), 4.48-4.38 (1H, m),

3.84-3.68 (2H, m), 3.24-3.15 (0.6H, m), 3.04-2.95 (0.4H, m).

2.92-2.76 (1H, m), 2.39-2.30 (1H, m), 2.26-2.17 (1H, m).

- 2) (2S, 4S)-4-フェノキシホモプロリン 塩酸塩
- 1) で得た(2S, 4S) -1-ベンジルオキシカルボニルー4-フェノキシホモプロリン ベンジルエステル11.09g(24.9mmol)をテトラヒドロフラン220mlに溶解し、20%水酸化パラジウム/炭素2.22gを加えて、水素雰囲気下に室温で6時間攪拌した。反応液に4N塩酸/ジオキサン溶液6.85ml(27.4mmol)を加えて口過し、口液を減圧濃縮して標記

の化合物 6.39 gを淡褐色粉末として得た(収率:定量的)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>)δppm:

12.70 (1H, br.s), 7.33 (2H, dd, J=8Hz, 7Hz), 6.99 (1H, t, J=7Hz),

6.96 (2H, d, J=8Hz), 5.16-5.09 (1H, m), 3.98-3.87 (1H, m),

3.50 (1H, dd, J=13Hz, 5Hz), 3.42-3.28 (2H, m),

2.89 (1H, dd, J=18Hz, 8Hz), 2.80 (1H, dd, J=18Hz, 6Hz),

2.64-2.54 (1H, m), 1.91-1.81 (1H, m).

3) (2S, 8aS) -2-フェノキシ-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a-オクタヒドロインドリジン-7-オン

(2S,4S) -4 - メトキシホモプロリン 塩酸塩の代わりに2)で得た(2S,4S) -4 - フェノキシホモプロリン 塩酸塩を用いて、参考例10-1)、10-2)、10-3)、10-4)及び10-5)と同様の反応を順次行ない、標記の化合物を淡褐色粉末として得た(収率25%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

7.28 (2H, dd, J=8Hz, 7Hz), 6.95 (1H, t, J=7Hz), 6.87 (2H, d, J=8Hz),

4.90-4.82 (1H, m), 3.40 (1H, d, J=11Hz), 3.39-3.32 (1H, m),

2.80-2.68 (1H, m), 2.67-2.27 (7H, m), 1.86-1.74 (1H, m).

#### (参考例24)

(8 a S) - 2 - エチリデン- 1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a - オクタヒドロインドリジン- 7 - オン

メチルトリフェニルホスホニウムプロミドの代わりにエチルトリフェニルホスホニウムプロミドを用いて参考例8-1) と同様の反応を行ない、得られた(S)-1-ベンジルオキシカルボニル-4-エチリデンプロリン メチルエステルを用いて、参考例11-1)、11-2)、11-3) 及び11-4) と同様の反応を順次行ない、標記の化合物を褐色油状物として得た(収率9%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ p p m: 5.45-5.30 (1H, m), 3.78 (0.5H, d, J=3Hz), 3.64 (0.5H, d, J=3Hz), 3.37-3.28 (1H, m), 2.94-2.85 (1H, m), 2.69-2.09 (8H, m), 1.68-1.61 (3H, m)。

10000

(参考例 2 5)

(8 a S) - 2 - プロピリデン-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a - オクタ ヒドロインドリジン-7 - オン

メチルトリフェニルホスホニウムプロミドの代わりにプロピルトリフェニルホスホニウムプロミドを用いて参考例8-1)と同様の反応を行ない、得られた(S) -1-ベンジルオキシカルボニル-4-プロピリデンプロリン メチルエステルを用いて、参考例11-1)、11-2)、11-3)及び11-4)と同様の反応を順次行ない、標記の化合物を褐色油状物として得た(収率10%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ p p m: 5.37-5.25 (1H, m), 3.78 (0.5H, d, J=3Hz), 3.62 (0.5H, d, J=3Hz), 3.36-3.28 (1H, m), 2.94-2.85 (1H, m), 2.69-2.10 (8H, m), 2.04-1.91 (2H, m), 1.01-0.92 (3H, m)。

(参考例26)

(8aS) - 2 - ベンジリデン-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタヒドロインドリジン-7-オン

メチルトリフェニルホスホニウムプロミドの代わりにベンジルトリフェニルホスホニウムプロミドを用いて参考例8-1)と同様の反応を行ない、得られた(S) -1-ベンジルオキシカルボニルー4-ベンジリデンプロリン メチルエステルを用いて、参考例11-1)、11-2)、11-3)及び11-4)と同様の反応を順次行ない、標記の化合物を褐色油状物として得た(収率0.4%)。

<sup>1</sup>H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δppm: 7.41-7.26 (4H, m), 7.21-7.15 (1H, m), 6.39-6.32 (1H, m), 4.70-4.02 (1H, m), 3.89-3.72 (1H, m), 3.40-3.35 (1H, m), 3.26-3.10 (1H, m), 2.98-2.78 (1H, m), 2.75-2.38 (5H, m), 2.11-1.84 (1H, m)。

(参考例27)

(2S, 8aS) - 2-エチル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オクタ ヒドロインドリジン-7-オン

(S) -1-ベンジルオキシカルボニル-4-メチリデンプロリン メチルエ

WO 03/015781 PCT/JP02/08276

446

1H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 3.28-3.23 (1H, m), 2.87 (1H, d, J=9Hz), 2.67-2.58 (1H, m),
- 2.56-2.40 (2H, m), 2.32-2.26 (4H, m), 2.13-2.05 (2H, m),
- 1.54-1.45 (2H, m), 1.18 (1H, d, J=6Hz), 0.90 (3H, t, J=7Hz).

(参考例28)

- (2S, 8aS) -2-プロピル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オク タヒドロインドリジン-7-オン
- (S) -1 ベンジルオキシカルボニル-4 メチリデンプロリン メチルエステルの代わりに(S) -1 ベンジルオキシカルボニル-4 プロピリデンプロリン メチルエステルを用いて、参考例8 -2)、8 -3)、8 -4)、8 -5) 及び8 -6) と同様の反応を順次行ない、標記の化合物を褐色油状物として得た(収率24%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 3.29-3.21 (1H, m), 2.87-2.73 (1H, m), 2.67-2.57 (1H, m),
- 2.53-2.41 (1H, m), 2.40-2.24 (3H, m), 2.22-2.09 (2H, m),
- 1.99-1.85 (1H, m), 1.83-1.56 (1H, m), 1.53-1.39 (2H, m),
- 1.37-1.22 (2H, m), 1.21-1.14 (1H, m), 0.93-0.86 (3H, m).

(参考例29)

- (2S, 8aS) + 2 ベンジル-1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8a-オク タヒドロインドリジン-7-オン
- (S) -1 ベンジルオキシカルボニル-4 メチリデンプロリン メチルエステルの代わりに(S) -1 ベンジルオキシカルボニル-4 ベンジリデンプロリン メチルエステルを用いて、参考例8-2)、8-3)、8-4)、8-5) 及び8-6) と同様の反応を順次行ない、標記の化合物を褐色油状物として得た(収率4%)。

 $^1$ H -核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDCl $_3$ )  $\delta$  ppm:7.38-7.28 (2H, m), 7.27-7.11 (3H, m), 3.36-3.23 (1H, m),

3.04-2.88 (1H, m), 2.86-2.21 (8H, m), 2.11-2.05 (1H, m),

2.02-1.72 (2H, m), 1.34-1.25 (2H, m).

(参考例30)

- (±) -1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン-7 オン

  - (±) -1-(t-7)トキシカルボニル)ホモプロリン5.03g(21.9 4mmo1)をジクロロメタン100mlに溶解し、N-メトキシ-N-メチルヒドロキシアミン塩酸塩2.57g(26.33mmo1)、1-エチル-3-(3'-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド5.05g(26.33mmo1)及びトリエチルアミン7.65ml(54.85mmo1)を加えて室温で1時間攪拌した。反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液を加えて分液し、有機層を水洗して無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒;ヘキサン:酢酸エチル=1:2)に付して、標記の化合物4.00gを無色油状物として得た(収率67%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル(400MHz, CDC1<sub>3</sub>)δppm:

- 4.28-4.12 (1H, br.s), 3.69 (3H, s), 3.45-3.25 (2H, br.s),
- 3.23-3.10 (3H, br.s), 3.09-2.83 (1H, m), 2.51-2.35 (1H, m),
- 2.14-1.98 (1H, m), 1.92-1.72 (3H, m), 1.46 (9H, s).
- 2) (±)-1-(t-プトキシカルボニル)-2-(2-オキソ-3-プ テニル) ピロリジン

えて酢酸エチルで抽出し、有機層を水洗して無水硫酸ナトリウムで乾燥後、減圧 濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶媒; ヘキサン:酢酸エチル=3:1)に付して、標記の化合物1.48gを無色油状物とし て得た(収率42%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 6.42-6.20 (2H, m), 5.88 (1H, dd, J=9Hz, 2Hz).
- 4.24-4.14 (1H, m), 3.47-3.23 (2.5H, m), 3.15-3.04 (0.5H, m),
- 2.60-2.44 (1H, m), 2.11-1.97 (1H, m), 1.90-1.77 (2H, m),
- 1.74-1.64 (1H, m), 1.46 (9H, s).
- 3) (±) -1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン-7-オン
- 2) で得た(±) -1-(t-ブトキシカルボニル) -2-(2-オキソ-3 -プテニル) ピロリジン140mg(0.59mmo1)をテトラヒドロフラン 2m1に溶解し、1N塩酸水溶液1.76m1(1.76mmo1)を加えて、 70℃で4時間攪拌した。反応液に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えてジク ロロメタンで抽出した。有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧 濃縮して、標記の化合物76mgを微褐色油状物として得た(収率93%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm:

- 3.36·3.30 (1H, m), 3.19·3.13 (1H, m), 2.69·2.58 (1H, m),
- 2.55-2.50 (1H, m), 2.38-2.19 (5H, m), 2.02-1.93 (2H, m),
- 1.87-1.80 (1H, m), 1.59-1.50 (1H, m).

## (参考例31)

- (±) -1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 8 a オクタヒドロインドリジン-7 オン
- 1) ( $\pm$ ) -1-(t-プトキシカルボニル) -2-[4-(p-トルエンスルホニル) -2-オキソプチル] ピロリジン

参考例 30-2)で得た( $\pm$ )-1-(t-プトキシカルボニル)<math>-2-(2-7+2)-3-7テニル)ピロリジン206 mg(10.86 mm o 1)をテトラヒドロフラン2 m 1 に溶解し、4-メチルチオフェノール107 mg(0.8

6 mmol) を加えて室温で2時間攪拌した。反応液を減圧濃縮して、得られた 残渣をジクロロメタン2 mlに溶解し、氷冷攪拌下に70 wt %m-クロロ過安 息香酸468 mg(1.894 mmol)を少量ずつ加え、室温で2時間攪拌し た。反応液に10%チオ硫酸ナトリウム水溶液及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶 液を順次加えて攪拌し、ジクロロメタンで抽出した。有機層を水洗して無水硫酸 マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、標記の化合物322 mgを無色油状物とし て得た(収率94%)。

1H-核磁気共鳴スペクトル(500MHz, CDCl<sub>3</sub>)δppm: 7.78 (2H, d, J=8Hz), 7.37 (2H, br.d, J=8Hz), 4.14-4.04 (1H, m), 3.48-3.22 (4H, m), 3.00-2.77 (3H, m), 2.49-2.35 (4H, m), 2.10-1.98 (1H, m), 1.86-1.74 (2H, m), 1.43 (9H, br.s), 1.33-1.22 (1H, m)。

- 2) (±)-1,2,3,5,6,7,8,8a-オクタヒドロインドリジン-7-オン
- 1)で得た(±)-1-(t-プトキシカルポニル)-2-[4-(p-トルエンスルホニル)-2-オキソプチル]ピロリジン322mg(0.814mm o1)をメタノール3.2mlに溶解し、4N塩酸/ジオキサン溶液0.61ml(2.44mmo1)を加えて、50℃で30分間攪拌した。反応混合物を減圧濃縮して溶媒と過剰の塩酸を留去し、残渣に飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて、ジクロロメタンで抽出した。有機層を水洗して無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、残渣をアルミナカラムクロマトグラフィー(溶媒;酢酸エチル)に付して、標記の化合物74mgを微褐色油状物として得た(収率65%)。1H-核磁気共鳴スペクトルにより、本化合物が(±)-1,2,3,5,6,7,8.8a-オクタヒドロインドリジン-7-オンであることを確認した。

(製剤例1) 製造例1の化合物の散剤

製造例1の化合物 5g、乳糖 895gおよびトウモロコシデンプン 10 0gをプレンダーで混合すると、散剤が得られる。

(製剤例2) 製造例2の化合物の顆粒剤

製造例2の化合物 5g、乳糖 865gおよび低置換度ヒドロキシプロピル

セルロース 100gを混合した後、10%ヒドロキシプロピルセルロース水溶液 300gを加えて練合する。これを押し出し造粒機を用いて造粒し、乾燥すると顆粒剤が得られる。

(製剤例3) 製造例3の化合物のカプセル剤

製造例3の化合物 5g、乳糖 115g、トウモロコシデンプン 58gおよびステアリン酸マグネシウム 2gをV型混合機を用いて混合した後、3号カプセルに180mgずつ充填するとカプセル剤が得られる。

(製剤例4) 製造例4の化合物の錠剤

製造例4の化合物 5g、乳糖 90g、トウモロコシデンプン 34g、結晶セルロース 20gおよびステアリン酸マグネシウム 1gをブレンダーで混合した後、錠剤機で打錠すると錠剤が得られる。

(製剤例5) 製造例6の化合物の配合剤

製造例6の化合物 5g、ジクロフェナックナトリウム 25g、乳糖 65g、トウモロコシデンプン 34g、結晶セルロース 20gおよびステアリン酸マグネシウム 1gをプレンダーで混合した後、錠剤機で打錠すると錠剤が得られる。

(実施例1)

糖尿病発症抑制試験(in vivo)

雌性の NOD マウスに、早期に糖尿病を発症させるため、9週齢時と11週齢時に、シクロホスファミド(250 gm/kg)を腹腔内投与した。粉末飼料に0.03%(化合物の投与量は20-40 gm/kg/dayに相当する)又は0.1%(化合物の投与量は90-130 gm/kg/dayに相当する)になるように試験化合物を混ぜ、1回目のシクロホスファミド投与日から4週間この飼料を与えることにより、試験化合物を投与した。試験化合物投与終了後に採血を行なって血糖値を測定し、血糖値が250 mg/dl以上のマウスを糖尿病発症とみなした。

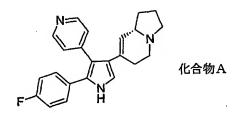
尚、これと同時に、試験化合物を混入していない粉末飼料を与えて同様の試験 を行ない、これを対照群とした。

結果は下記表22の通りであった。

表 2 2

化合物濃度(化合物の投与量)	マウス全数	糖尿病発症マウス数
0.03% (20-40 gm/kg/day)	1 0	.3
0.1% (90-130 gm/kg/day)	1 0	1
0%	1 0	. 9
	0.03% (20-40 gm/kg/day) 0.1% (90-130 gm/kg/day)	0.1% (90-130 gm/kg/day) 1 0

尚、表中、「化合物A」とは例示化合物番号1-302の化合物の光学活性体 (EP-1070711A、実施例83)であり、下記の構造を有する。



上記表22から明らかな通り、化合物Aは、糖尿病の発症を抑制した。

## [産業上の利用可能性]

マウスを用いた糖尿病のモデルにおいて、前記一般式(I)を有する化合物は、 糖尿病発症処理後に投与したところ、糖尿病の指標である、血糖値の上昇を抑制 するので、糖尿病(好適には、I型糖尿病)の予防又は治療剤として有用である。

## 請求の範囲

## 1. 下記一般式(I):

$$R^2$$
 $A - R^3$ 
(I)

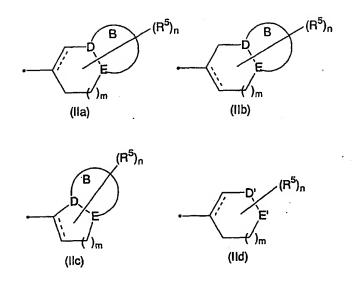
{式中、

Aは、置換基群δで置換されてもよい、ベンゼン、ピリジン、ピリダジン、 ピリミジン、ピロール、フラン、チオフェン、ピラゾール、イミダゾール、イ ソキサゾール及びイソチアゾールから選択される三価の基を示し、

 $R^{1}$ は、アリール基;置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたアリール基;ヘテロアリール基;又は置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたヘテロアリール基を示し、

 $R^2$ は、窒素原子を少なくとも一つ有するヘテロアリール基;又は置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換された、窒素原子を少なくとも一つ 有するヘテロアリール基を示し、

R<sup>3</sup>は、下記一般式(IIa)、(IIb)、(IIc) 又は(IId) を有する基:



[式中、

点線を含む結合は、単結合又は二重結合を示し、

mは、1又は2を示し、

 $R^5$ は、水素原子、置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から任意に選択される基を示し、

nは1乃至3を示し(nが2以上の場合は、R<sup>5</sup>は、同一又は異なっても良い)、

D及びEの一方は、窒素原子を示し、他方は、式>C(R<sup>6</sup>) ーを有する基 (式中、R<sup>6</sup>は、水素原子、置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される 1 個の 基を示す。)を示し、

D'及びE'の一方は、式>N( $R^6$ ')を有する基(式中、 $R^6$ 'は、水素原子、置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される 1 個の基を示す。)を示し、他方は、式>C( $R^6$ )( $R^6$ '')を有する基(式中、 $R^6$  及び $R^6$ '' は、同一若しくは異なって、水素原子、置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される 1 個の基を示す。)を示し、

D及びEを含む環Bは、4乃至7員ヘテロシクリル環(該環は飽和であるか不飽和であり;アリール基、ヘテロアリール基、シクロアルキル基又はヘテロシクリル基と縮環していてもよい。)を示す。]を示し、

置換基群  $\alpha$  は、水酸基、ニトロ基、シアノ基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、ハロゲノ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、ハロゲノ低級アルキルチオ基及び式 $-NR^aR^b$ を有する基(式中、 $R^a$ 及び $R^b$ は、同一若しくは異なって、それぞれ、水素原子、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、アラルキル基又は低級アルキルスルホニル基を示すか、或いは、 $R^a$ 及び $R^b$ が結合している窒素原子と一緒になって、ヘテロシクリル基を形成する。)からなる群を示し、

置換基群 $\beta$ は、低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルキニル基、アラルキル基、シクロアルキル基、置換基群 $\alpha$ から選択される基で置換された低級アルキル基、置換基群 $\alpha$ から選択される基で置換された低級アルケニル基および置換基群 $\alpha$ から選択される基で置換されたアルキニル基からなる群を示し、

置換基群 $\gamma$ は、オキソ基、ヒドロキシイミノ基、低級アルコキシイミノ基、低級アルキレン基、低級アルキレンジオキシ基、低級アルキルスルフィニル基、低級アルキルスルホニル基、アリール基、置換基群 $\alpha$ 及び置換基群 $\beta$ から選択される基で置換されたアリール基、アリールオキシ基、置換基群 $\alpha$ 及び置換基群 $\beta$ から選択される基で置換されたアリールオキシ基、低級アルキリデン基およびアラルキリデン基からなる群を示し、

置換基群 $\delta$ は、置換基群 $\beta$ から選択される1つの基;置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたシクロアルキル基;アリール基;置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたアリール基;ヘテロアリール基;置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたヘテロアリール基;ヘテロシクリル基;および置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたヘテロシクリル基からなる群を示す。

但し、 $R^1$ 及び $R^3$ が結合している環A上の原子は、それぞれ、 $R^2$ が結合している環A上の原子に隣接している。}

を有する化合物、その薬理上許容される塩、その薬理上許容されるエステル又はその他の誘導体を有効成分として含有する、糖尿病を予防若しくは治療する

ための医薬組成物。

- 2. 請求の範囲第1項において、一般式(I)を有する化合物におけるAが、 2個の置換基群 $\delta$ で置換されてもよいピロール、1 個の置換基群 $\delta$ で置換されて もよいピラゾール及び1 個の置換基群 $\delta$ で置換されてもよいイミダゾールから選 択される三価の基である医薬組成物。
- 3. 請求の範囲第1項において、一般式 (I)を有する化合物におけるAが、 2個の置換基群δで置換されてもよいピロール及び1個の置換基群δで置換され てもよいピラゾールから選択される三価の基である医薬組成物。
- 4. 請求の範囲第1項において、一般式(I)を有する化合物が、下記のいずれか1個の一般式で表される化合物である医薬組成物:

(式中、R $^4$ 及びR $^4$ )は、同一又は異なって、水素原子又は置換基群  $\delta$  を示す。)。

5. 請求の範囲第1項において、一般式(I)を有する化合物が、下記一般式で表される化合物である医薬組成物:

(式中、R $^4$ 及びR $^4$ 'は、同一又は異なって、水素原子又は置換基群 $^6$ を示す。)。

6. 請求の範囲第1項乃至第5項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物における $R^1$ が、アリール基;又は置換基群 $\alpha$ 及び置換基群 $\beta$ から選択される基で置換されたアリール基である医薬組成物。

- 7. 請求の範囲第1項乃至第5項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物における $R^1$ が、フェニル、ナフチル、又は置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたフェニル若しくはナフチルである医薬組成物。
- 8. 請求の範囲第1項乃至第5項から選択されるいずれか1項において、一般式 (I) を有する化合物における $R^1$ が、フェニル、又は置換基群  $\alpha^1$ 及び 置換基群  $\beta^1$ から選択される基で置換されたフェニルであり、

置換基群  $\alpha^1$  が、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、ハロゲノ低級アルコキシ基および - N R  $^a$  R  $^b$  を有する基(式中、R  $^a$  及び R  $^b$  の一方は水素原子又は低級アルキル基を示し、他方は水素原子、低級アルキル基又はアラルキル基を示す。)からなる群を示し、

置換基群 $\beta$ <sup>1</sup>が、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基、ニトロ低級アルキル基、アミノ低級アルキル基、モノ(低級アルキル)アミノ低級アルキル基はよびモノ(アラルキル)アミノ低級アルキル基からなる群を示す医薬組成物。

- 9. 請求の範囲第1項乃至第5項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物における $R^1$ が、フェニル、又はハロゲン原子、ハロゲノ低級アルキル基およびハロゲノ低級アルコキシ基からなる置換基群から選択される基で置換されたフェニルである医薬組成物。
- 10. 請求の範囲第1項乃至第5項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物におけるR<sup>1</sup>が、フェニル、4-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、3-クロロフェニル、3,4-ジフルオロフェニル、3,4,5-トリフルオロフェニル、3-クロロ-4-フルオロフェニル、3-ジフルオロメトキシフェニル又は3-トリフルオロメチルフェニルである医薬組成物。
- 11. 請求の範囲第1項乃至第10項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物における $R^2$ が、窒素原子を1若しくは2個含む 5乃至6員へテロアリール基;又は置換基群 $\alpha$ 及び置換基群 $\beta$ から選択される基で置換された、窒素原子を1若しくは2個含む5乃至6員へテロアリール基

である医薬組成物。

- 12. 請求の範囲第1項乃至第10項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物における $R^2$ が、ピリジル、ピリミジニル、又は置換基群 $\alpha$ 及び置換基群 $\beta$ から選択される基で置換されたピリジル若しくはピリミジニルである医薬組成物。
- 13. 請求の範囲第1項乃至第10項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物における $R^2$ が、4-ピリジル、4-ピリミジニル、又は置換基群 $\alpha$ 及び置換基群 $\beta$ から選択される基で置換された4-ピリジル若しくは4-ピリミジニルである医薬組成物。
- 14. 請求の範囲第1項乃至第10項から選択されるいずれか1項において、一般式 (I) を有する化合物における $R^2$ が、4-ピリジル、4-ピリミジニル、又は置換基群 $\alpha$ 及び置換基群 $\beta$ から選択される1個の基で2位が置換された4-ピリジル若しくは4-ピリミジニルである医薬組成物。
- 15. 請求の範囲第1項乃至第10項から選択されるいずれか1項において、
  一般式(I)を有する化合物におけるR<sup>2</sup>が、4ーピリジル、4ーピリミジニ
  ル、又はメトキシ、アミノ、メチルアミノ、ベンジルアミノ及びαーメチルベ
  ンジルアミノからなる置換基群から選択される1個の基で2位が置換された
  4ーピリジル若しくは4ーピリミジニルである医薬組成物。
- 16. 請求の範囲第1項乃至第15項から選択されるいずれか1項において、一般式 (I) を有する化合物における $R^3$ が、一般式 (IIa)、(IIb) 又は (IId) を有する基であり、
- D及びEを含む環Bが、1個の窒素原子を含有し、更に窒素原子、酸素原子、硫黄原子、式>SOを有する基及び式>SO₂を有する基からなる群より選択される1個の原子又は基を含有していてもよい5又は6員へテロサイクル環(該環は飽和であるか不飽和であり;アリール基、ヘテロアリール基、シクロアルキル基又はヘテロシクリル基と縮環していてもよい。)である医薬組成物。
- 17. 請求の範囲第1項乃至第15項から選択されるいずれか1項において、一般式 (I) を有する化合物における $R^3$ が、一般式 (IIa)、(IIb) 又は (IId) を有する基であり、

- D及びEを含む環Bが、1個の窒素原子を含有する5又は6員ヘテロサイクル環(該環は飽和であるか不飽和であり;アリール基、ヘテロアリール基、シクロアルキル基又はヘテロシクリル基と縮環していてもよい。)である医薬組成物。
- 18. 請求の範囲第1項乃至第15項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物における $R^3$ が、一般式(IIa)又は(IIb)を有する基であり、D及びEを含む環Bが、ピロリジン又はピロリンである医薬組成物。
- 19. 請求の範囲第1項乃至第15項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物における $R^3$ が、一般式(IIa)を有する基であり、D及びEを含む環Bが、ピロリジン又はピロリンである医薬組成物。
- 20. 請求の範囲第1項乃至第19項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物におけるDが、式>C(R6) -を有する基(式中、R6は、水素原子、置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される1個の基を示す。)であり、Eが窒素原子である医薬組成物。
- 21. 請求の範囲第1項乃至第19項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物におけるDが、式>CH-を有する基である医薬組成物。
- 22. 請求の範囲第1項乃至第21項から選択されるいずれか1項において、 一般式(I)を有する化合物におけるmが1である医薬組成物。
- 2 3. 請求の範囲第1項乃至第22項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物における $R^5$ が、水素原子、置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から任意に選択される基であり、nが1又は2である医薬組成物。
- 24. 請求の範囲第1項乃至第22項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物における $R^5$ が、水素原子、水酸基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、ハロゲノ低級アルコキシ基、低級アルキルチオ基、低級アルキル基、ハロゲノ低級アルキル基、オキソ基、アリール基、置換基群  $\alpha$ 及び置換基群 $\beta$ から選択される基で置換されたアリール基、低級アルキレン基、

低級アルキレンジオキシ基、低級アルキルスルホニル基、アリールオキシ基、 置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたアリールオキシ基、 低級アルキリデン基並びにアラルキリデン基から任意に選択される基であり、 n が 1 又は 2 である医薬組成物。

- 25. 請求の範囲第1項乃至第22項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物における $R^5$ が、水素原子、水酸基、フッ素原子、塩素原子、メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、メチル基、エチル基、プロピル基、ブチル基、フェニル基、置換基群  $\alpha$  及び置換基群  $\beta$  から選択される基で置換されたフェニル基、フェノキシ基、メチリデン基、エチリデン基、プロピリデン基並びにベンジリデン基から任意に選択される基であり、n が1又は2である医薬組成物。
- 26. 請求の範囲第1項乃至第22項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物におけるR<sup>5</sup>が、水素原子、メトキシ基、メチル基、エチル基、プロピル基、ブチル基、フェニル基、フェノキシ基、メチリデン基、エチリデン基、プロピリデン基又はベンジリデン基であり、nが1である医薬組成物。
- 27. 請求の範囲第1項乃至第26項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物における置換基群 $\delta$ が、低級アルキル基;置換基群 $\alpha$ から選択される基で置換された低級アルキル基;置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたアリール基;ヘテロシクリル基;及び置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたアリール基;ヘテロシクリル基;及び
- 28. 請求の範囲第1項乃至第26項から選択されるいずれか1項において、一般式(I)を有する化合物における置換基群 $\delta$ が、低級アルキル基;ハロゲノ低級アルキル基;及び置換基群 $\alpha$ 、置換基群 $\beta$ 及び置換基群 $\gamma$ から選択される基で置換されたフェニル基からなる群である医薬組成物。
- 29. 請求の範囲第1項乃至第26項から選択されるいずれか1項において、 一般式 (I) を有する化合物における置換基群δが、メチル基、エチル基、プロピル基及びフェニル基からなる群である医薬組成物。

ピラゾール、

- 30. 請求の範囲第1項において、一般式(I)を有する化合物が下記から選択される化合物である医薬組成物:
- ・2 (4-7)ルオロフェニル) 4-[(2R, 8aS) 2-7ェニルー 1, 2, 3, 5, 6, 8a-4サヒドロインドリジン-7-7ル] 3-(ピリジン-4-7) 1H-ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル) -4-[(8aS)-2-メチル-1, 2,

- 2, 3, 5, 6, 8 a  $\wedge$  キサヒドロインドリジン- 7 イル] 3 (ピリジン- 4 イル) 1 H ピロール、

- ・2 (4-フルオロフェニル) -4- [(2S, 8aS) 2-プロピル-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] 3-(ピリジン-4-イル) 1 H-ピロール、
- ・5 (3 フルオロフェニル) 3 (1, 2, 3, 5, 6, 8 a  $\wedge$  キサヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール、・5 (4 フルオロフェニル) 3 (1, 2, 3, 5, 6, 8 a  $\wedge$  キサヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール、・5 (4 フルオロフェニル) 3 (2 メチル- 1, 2, 3, 5, 6, 8 a  $\wedge$  キサヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル)
- ・5 (4 フルオロフェニル) 3 (2 フェニル- 1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル)

ピラゾール、

- ・5 (3 クロロフェニル) 3 (1, 2, 3, 5, 6, 8 a  $\wedge$  + + ヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール、・3 (1, 2, 3, 5, 6, 8 a  $\wedge$  + + ヒドロインドリジン- 7 イル) 4 (ピリジン- 4 イル) 5 (3 トリフルオロメチルフェニル) ピラゾール、
- ・5-(3,4-ジフルオロフェニル) -3-(1,2,3,5,6,8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル) -4-(ピリジン-4-イル) ピラゾール、
- ・3 (2-x+y-1, 2, 3, 5, 6, 8a-x+y+y-y-1) (2-x+y-1) (4-y+y-1) - ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-7)ロピル-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-4+サヒドロインドリジン-7-7ル)-4-(2)ジン-4-7ル)ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-3) チリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8 a-4 キサヒドロインドリジン-7-7 ル)-4-(2) ピラゾール、
- ・3 (2 エチリデン- 1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン- 7 イル) 5 (4 フルオロフェニル) 4 (ピリジン- 4 イル) ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-7)ロピリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8a-4+サヒドロインドリジン-7-4ル)-4-(ピリジン-4-4)ル)ピラゾール、
- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-3) チルー3, 5, 6, 8 a-7 トラヒドロインドリジン-7-7 ル)-4-(2) ピラゾール、

ル、

- ・5-(4-7)ルオロフェニル)-3-(2-7)ロピル-3, 5, 6, 8a-テトラヒドロインドリジン-7-イル)-4-(ピリジン-4-イル)ピラゾール、
- ・4 [(8 a S) -1, 2, 3, 5, 6, 8 a -ヘキサヒドロインドリジン -7 -イル] -2 -フェニル-3 -(ピリジン-4 -イル) -1 H -ピロール、
- ・2 (4-7)ルオロフェニル) 4-[(8aS)-1, 2, 3, 5, 6, 8a-4サヒドロインドリジン-7-7ル]-3-(ピリジン-<math>4-7ル)
- -1H-ピロール、
- ・2 (4-フルオロフェニル)-3- (ピリジン-4-イル)-4- [(8aS)-3,5,6,8a-テトラヒドロインドリジン-7-イル]-1 H-ピロール、
- ・2 (3-フルオロフェニル)-4- [(8aS)-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-3- (ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・2 (3-クロロフェニル) -4- [(8aS) -1, 2, 3, 5, 6, 8 a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル] -3- (ピリジン-4-イル) -1 H-ピロール、
- ・ $4-[(8aS)-1, 2, 3, 5, 6, 8a-\Lambda$ キザヒドロインドリジン-7-1ル]-3-(ピリジン-4-1ル]-2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1 H-ピロール、
- ・4-[(8aS)-2-xチルー3, 5, 6, 8a-テトラヒドロインドリジンー7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジンー4-イ

- ル)-1H-ピロール、

- 6,8 a テトラヒドロインドリジン- 7 イル] 3 (ヒリジン-4-4)ル) 1 H ピロール、
- ・4-[(8aS)-2-エチリデン-1, 2, 3, 5, 6, 8a-ヘキサヒドロインドリジン-7-イル]-2-(4-フルオロフェニル)-3-(ピリジン-4-イル)-1 H-ピロール、
- ・2 (4-フルオロフェニル) -4 [(8 a S) -2 (2-プロピリデン) -1, 2, 3, 5, 6, 8 a ヘキサヒドロインドリジン<math>-7 7ル] 3 (ピリジン<math>-4 7ル) -1 H ピロール及び
- ・5 (4-7)ルオロフェニル) -4 (2) ジン-4-イル) -3 (3, 5, 6, 8a テトラヒドロインドリジン-7 イル) ピラゾール。
- 31. 糖尿病がI型糖尿病である、請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項に記載の医薬組成物。
- 32. 糖尿病を予防若しくは治療するための医薬組成物を製造するための、 請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項に特定された化 合物、その薬理上許容される塩、その薬理上許容されるエステル又はその他の 誘導体の使用。
- 33. 請求の範囲第1項乃至第30項から選択されるいずれか1項に特定された化合物、その薬理上許容される塩、その薬理上許容されるエステル又はその他の誘導体の有効量を、哺乳動物に投与することからなる、糖尿病の予防若しくは治療方法。

International application No.
PCT/JP02/08276

		L	
	SIFICATION OF SUBJECT MATTER .Cl <sup>7</sup> A61K31/444, 31/506, A61P3	/10, C07D471/04	
	to International Patent Classification (IPC) or to both n	national classification and IPC	
	DS SEARCHED		
	Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) Int.Cl <sup>7</sup> A61K31/444, 31/506, A61P3/10, C07D471/04		
	ation searched other than minimum documentation to the		
	data base consulted during the international search (name LUS (STN), REGISTRY (STN)	ne of data base and, where practicable, sear	rch terms used)
C. DOCU	JMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where a	ppropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Х	EP 1070711 A2 (Sankyo Co., I 24 January, 2001 (24.01.01), Full text; particularly, Clas [0716] & JP 2001-247564 A & AU & CN 1295069 A	ims; page 352, Par. No.	1-32
E,X	JP 2002-284779 A (Sankyo Co., Ltd.), 1-32 03 October, 2002 (03.10.02), Full text; particularly, Claim 31 (Family: none)		1-32
P,X	WO 02/57265 A1 (Sankyo Co., 25 July, 2002 (25.07.02), Full text & JP 2002-284782 A	Ltd.),	1–32
× Further	er documents are listed in the continuation of Box C.	See patent family annex.	,
"A" docume conside "E" earlier of date "L" docume cited to special docume means docume than the	document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance  earlier document but published on or after the international filing date  document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)  document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means		the application but cited to carlying the invention cannot be red to involve an inventive claimed invention cannot be when the document is documents, such skilled in the art family
Name and m Japa:	nailing address of the ISA/ nese Patent Office	Authorized officer	i
Facsimile No.		Telephone No.	

International application No.
PCT/JP02/08276

Category*	tion). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT  Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.	
P, X	WO 02/57264 A1 (Sankyo Co., Ltd.), 25 July, 2002 (25.07.02), Full text & JP 2002-284783 A		
P,X	WO 02/57255 A1 (Sankyo Co., Ltd.), 25 July, 2002 (25.07.02), Full text & JP 2002-284780 A	1-32	
į			
		-	

International application No. PCT/JP02/08276

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)
This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:
1. X Claims Nos.: 33
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:  Claim 33 pertains to methods for treatment of the human body by therapy, and thus relates to a subject matter which this International Searching Authority is not required to search.
2. Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:
3. Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).
Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)
This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:
1. As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.
2. As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:
No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:
Remark on Protest The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.
No protest accompanied the payment of additional search fees.

International application No. PCT/JP02/08276

Concerning claims 1-32

Claim 1 includes extremely many compounds as active ingredients of pharmaceutical compositions for the prevention or treatment of diabetes.

However, only a small part of the claimed compounds are supported by the description within the meaning of PCT Article 6 and disclosed within the meaning of PCT Article 5.

Therefore, this search has been made only on the part of compounds which are supported by the description and disclosed.

The same applies to claims 2 to 32.

.....

Form PCT/ISA/210 (extra sheet) (July 1998)

			-,
A. 発明の Int.C	A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類 (IPC)) Int. Cl <sup>7</sup> A61K31/444, 31/506, A61P3/10, C07D471/04		
B. 調査を	行った分野		
調査を行った	最小限資料(国際特許分類(IPC))		
Int. C	1' A61K31/444, 31/506,	A61P3/10, C07D471/04	
最小限資料以	外の資料で調査を行った分野に含まれるもの		
国際調本では	田」を命えば、たら、一(一)		
1	用した電子データベース (データベースの名称		
CAP	LUS (STN), REGISTRY (STN	<b>()</b>	
C. 関連する	ると認められる文献		
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の傍底が間ませる	hather zonest har were also	関連する
Х	引用文献名 及び一部の箇所が関連する EP 1070711 A2 (SANKYO COMPANY LI	MITED 2001 01 24	請求の範囲の番号
	文献全体、特に、請求の範囲、第3 & JP 2001-247564 A & AU 4875500	52頁の段落「0716]参昭	1-32
EΧ	JP 2002-284779 A (三共株式会社) 2002.10.03, 文献全体、特に、請求の範囲·3 1参照 (ファミリーなし)		1-32
PΧ	WO 02/57265 A1 (三共株式会社) 20 & JP 2002-284782 A	02.07.25,文献全体参照	1-32
X C欄の続き	X C欄の続きにも文献が列挙されている。		紙を参照。
* 引用文献のカテゴリー 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表された文献であっ出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理のとめに引用するもの 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献(理由を付す) 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願「&」同一パテントファミリー文献		明の原理又は理論 該文献のみで発明 られるもの 該文献と他の1以 明である紹会せに	
国際調査を完了した日 国際調査報告の発送日 26 11 02		1.00	
四个国符部厅(ISA/JP) 郵便番号100-8915		特許庁審査官 (権限のある職員) 谷尾 忍	4P 9550 内線 3491

C(続き).	関連すると認められる文献	
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
PX	WO 02/57264 A1 (SANKYO COMPANY, LIMITED) 2002.07.25, 文献全体参照 & JP 2002-284783 A	1-32
PX	₩0 02/57255 A1 (三共株式会社) 2002.07.25, 文献全体参照 & JP 2002-284780 A	1-32
	·	
	- 4° - 4°	
		₹₹.
Ÿ		-
	·	

第I欄	請求の範囲の一部の調査ができないときの意見(第1ページの2の続き)
法第8条 成しなか	条第3項(PCT17条(2)(a))の規定により、この国際調査報告は次の理由により請求の範囲の一部について作
1. X	請求の範囲 33 は、この国際調査機関が調査をすることを要しない対象に係るものである。 つまり、
	請求の範囲33は、治療による人体の処置方法であり、この国際調査機関が国際調査 をすることを要しない対象に係るものである。
2.	請求の範囲 は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない国際出願の部分に係るものである。つまり、
3. 🗍	請求の範囲は、従属請求の範囲であってPCT規則6.4(a)の第2文及び第3文の規定に 従って記載されていない。
第Ⅱ欄	発明の単一性が欠如しているときの意見 (第1ページの3の続き)
次に並	☆べるようにこの国際出願に二以上の発明があるとこの国際調査機関は認めた。
1. []	出願人が必要な追加調査手数料をすべて期間内に納付したので、この国際調査報告は、すべての調査可能な請求 の範囲について作成した。
2.	追加調査手数料を要求するまでもなく、すべての調査可能な請求の範囲について調査することができたので、追 加調査手数料の納付を求めなかった。
3.	出願人が必要な追加調査手数料を一部のみしか期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、手数料の納付のあった次の請求の範囲のみについて作成した。
4.	出願人が必要な追加調査手数料を期間内に納付しなかったので、この国際調査報告は、請求の範囲の最初に記載されている発明に係る次の請求の範囲について作成した。
追加調査	〔手数料の異議の申立てに関する注意 〕 追加調査手数料の納付と共に出願人から異議申立てがあった。

## 請求の範囲1-32について

請求の範囲1は、糖尿病を予防若しくは治療するための医薬組成物の有効成分として、非 常に多数の化合物を包含している。

しかしながら、PCT6条の意味において明細書に裏付けられ、また、PCT5条の意味において開示されているのは、クレームされた化合物のごくわずかな部分に過ぎない。

よって、調査は、明細書に裏付けられ、開示されている部分について行った。 請求の範囲2-32についても同様である。

# THIS PAGE BLANK (USPTO)